

PCT

WELTORGANISATION FÜR GEISTIGES EIGENTUM  
Internationales Büro



INTERNATIONALE ANMELDUNG VERÖFFENTLICHT NACH DEM VERTRAG ÜBER DIE  
INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS (PCT)

(51) Internationale Patentklassifikation <sup>7</sup> :	A1	(11) Internationale Veröffentlichungsnummer: WO 00/68228 (43) Internationales Veröffentlichungsdatum: 16. November 2000 (16.11.00)
C07D 417/06, 403/06, 413/06, A01N 43/76, 43/78, 43/828, 43/647		
(21) Internationales Aktenzeichen:	PCT/EP00/04040	Mannheim (DE). OTTEN, Martina [DE/DE]; Gunterstrasse 28, D-67069 Ludwigshafen (DE). WESTPHALEN, Karl-Otto [DE/DE]; Zum Pfauenturm 17, D-67346 Speyer (DE). WALTER, Helmut [DE/DE]; Grünstadter Strasse 82, D-67283 Obrigheim (DE).
(22) Internationales Anmelde datum:	5. Mai 2000 (05.05.00)	(74) Anwälte: KINZEBACH, Werner usw.; Ludwigsplatz 4, D-67059 Ludwigshafen (DE).
(30) Prioritätsdaten:	199 21 240.6 7. Mai 1999 (07.05.99) DE	(81) Bestimmungsstaaten: AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BY, CA, CH, CN, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EE, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, NO, NZ, PL, PT, RO, RU, SD, SE, SG, SI, SK, SL, TJ, TM, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VN, YU, ZA, ZW, ARIPO Patent (GH, GM, KE, LS, MW, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZW), eurasisches Patent (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), europäisches Patent (AT, BE, CH, CY, DE, DK, ES, FI, FR, GB, GR, IE, IT, LU, MC, NL, PT, SE), OAPI Patent (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG).
(71) Anmelder ( <i>für alle Bestimmungsstaaten ausser US</i> ): BASF AKTIENGESELLSCHAFT [DE/DE]; D-67056 Ludwigshafen (DE).		
(72) Erfinder; und		Veröffentlicht
(75) Erfinder/Anmelder ( <i>nur für US</i> ): MAYER, Guido [DE/DE]; Gutleuthausstrasse 8, D-67433 Neustadt (DE). BAUMANN, Ernst [DE/DE]; Falkenstrasse 6a, D-67373 Dudenhofen (DE). DEYN, Wolfgang von [DE/DE]; An der Bleiche 24, D-67435 Neustadt (DE). KUDIS, Steffen [DE/DE]; Spelzenstrasse 10, D-68167 Mannheim (DE). LANGEMANN, Klaus [DE/DE]; Goldbergstrasse 18, D-67551 Worms (DE). MISSLITZ, Ulf [DE/DE]; Mandelring 74, D-67433 Neustadt (DE). NEIDLEIN, Ulf [DE/DE]; Brahmstrasse 3, D-68165 Mannheim (DE). WITSCHEL, Matthias [DE/DE]; Wittelsbachstrasse 81, D-67061 Ludwigshafen (DE). RACK, Michael [DE/DE]; Sandwingert 67, D-69123 Heidelberg (DE). VOLK, Thorsten [DE/DE]; Strassburger Ring 16-18, D-68229	<i>Mit internationalem Recherchenbericht.</i>	
(54) Title: 4-(3',4'-HETEROCYCLYL BENZOYL) PYRAZOLES AS HERBICIDAL AGENTS		
(54) Bezeichnung: 4-(3',4'-HETEROCYCLYL BENZOYL) PYRAZOLE ALS HERBIZIDE		
(57) Abstract		
The invention relates to pyrazolyl derivatives of benzo-condensed, unsaturated 5-membered nitrogen heterocycles of the general formula (I), wherein X represents N or a group C-R <sup>3</sup> ; Y is O, S, SO, SO <sub>2</sub> or NR <sup>4</sup> or X-Y is S=N, and wherein X means sulfur; and the variables R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> and Pz have the meanings indicated in claim 1. The invention further relates to a method of producing said compounds, to agents that contain them and to their use as herbicidal agents.		
(57) Zusammenfassung		
Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrazolyl-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel (I), worin X für N oder eine Gruppe C-R <sup>3</sup> steht; Y für O, S, SO, SO <sub>2</sub> oder NR <sup>4</sup> steht oder X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet; und die Variablen R <sup>1</sup> , R <sup>2</sup> und Pz die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen aufweisen. Die vorliegende Verbindung betrifft weiterhin ein Verfahren zur Herstellung dieser Verbindungen, Mittel, die diese Verbindungen enthalten, und ihre Verwendung als Herbizide.		

**LEDIGLICH ZUR INFORMATION**

Codes zur Identifizierung von PCT-Vertragsstaaten auf den Kopfbögen der Schriften, die internationale Anmeldungen gemäß dem PCT veröffentlichen.

AL	Albanien	ES	Spanien	LS	Lesotho	SI	Slowenien
AM	Armenien	FI	Finnland	LT	Litauen	SK	Slowakia
AT	Österreich	FR	Frankreich	LU	Luxemburg	SN	Senegal
AU	Australien	GA	Gabun	LV	Lettland	SZ	Swasiland
AZ	Aserbaidschan	GB	Vereinigtes Königreich	MC	Monaco	TD	Tschad
BA	Bosnien-Herzegowina	GE	Georgien	MD	Republik Moldau	TG	Togo
BB	Barbados	GH	Ghana	MG	Madagaskar	TJ	Tadschikistan
BE	Belgien	GN	Guinea	MK	Die ehemalige jugoslawische Republik Mazedonien	TM	Turkmenistan
BF	Burkina Faso	GR	Griechenland	ML	Mali	TR	Türkei
BG	Bulgarien	HU	Ungarn	MN	Mongolei	TT	Trinidad und Tobago
BJ	Benin	IE	Irland	MR	Mauretanien	UA	Ukraine
BR	Brasilien	IL	Israel	MW	Malawi	UG	Uganda
BY	Belarus	IS	Island	MX	Mexiko	US	Vereinigte Staaten von Amerika
CA	Kanada	IT	Italien	NE	Niger	UZ	Usbekistan
CF	Zentralafrikanische Republik	JP	Japan	NL	Niederlande	VN	Vietnam
CG	Kongo	KE	Kenia	NO	Norwegen	YU	Jugoslawien
CH	Schweiz	KG	Kirgisistan	NZ	Neuseeland	ZW	Zimbabwe
CI	Côte d'Ivoire	KP	Demokratische Volksrepublik Korea	PL	Polen		
CM	Kamerun	KR	Republik Korea	PT	Portugal		
CN	China	KZ	Kasachstan	RO	Rumänien		
CU	Kuba	LC	St. Lucia	RU	Russische Föderation		
CZ	Tschechische Republik	LI	Liechtenstein	SD	Sudan		
DE	Deutschland	LK	Sri Lanka	SE	Schweden		
DK	Dänemark	LR	Liberia	SG	Singapur		
EE	Estland						

## 4-(3', 4'-HETEROCYCLYLBENZOYL) PYRAZOLE ALS HERBIZIDE

## 5 Beschreibung

Die vorliegende Erfindung betrifft Pyrazolyl-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen, Verfahren zur Herstellung derartiger Pyrazolyl-Derivate, Mittel, die 10 derartige Verbindungen enthalten, sowie die Verwendung der Pyrazolyl-Derivate oder Mittel, die diese enthalten, zur Schadpflanzenbekämpfung.

Aus der WO 96/05197 sind Saccharin-Derivate mit herbizider Wirkung bekannt, die am Benzolkern des Saccharingerüstes mit einem (5-Hydroxy-pyrazol-4-yl)carbonyl-Rest substituiert sind. Die WO 97/30993 und die WO 97/09327 beschreiben Dioxothiochroman-Derivate und Dihydrobenzothiophen-Derivate mit herbizider Wirkung, die ebenfalls am Benzolkern der Schwefel-Heterocyclen einen 20 (5-Hydroxypyrazol-4-yl)carbonyl-Rest aufweisen.

Aus der WO 97/08164 sind unter anderem benzokondensierte Derivate des  $\gamma$ -Butyrolactams mit herbizider Wirkung bekannt, die ebenfalls einen (5-Hydroxypyrazol-4-yl)carbonyl-Rest aufweisen.

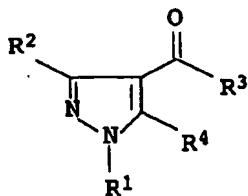
25

Die herbiziden Eigenschaften der aus den genannten Druckschriften bekannten Verbindungen sowie deren Verträglichkeiten gegenüber Kulturpflanzen vermögen jedoch nur bedingt die Anforderungen an Herbizide zu befriedigen.

30

Die EP-A-822 187 beschreibt Herbizide auf der Basis arylsubstituierter Pyrazole der allgemeinen Formel

35



40

worin R<sup>1</sup> für Wasserstoff oder eine für ein Pestizid geeignete 45 Schutzgruppe steht, R<sup>4</sup> vorzugsweise Wasserstoff bedeutet und R<sup>2</sup> sowie R<sup>3</sup> für Phenyl, Naphthyl oder heterocyclische Gruppen stehen, die gegebenenfalls substituiert sein können. R<sup>3</sup> steht vorzugsweise

## 2

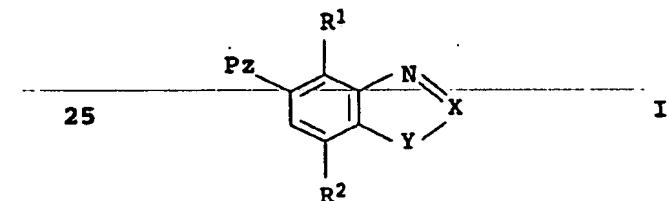
für einen 5- oder 6-gliedrigen heterocyclischen Ring und insbesondere für eine Thiophengruppe. Die herbizide Wirkung der in dieser Schrift beschriebenen Verbindungen sowie ihre Verträglichkeit gegenüber Nutzpflanzen ist ebenfalls nicht zufriedenstellend.

5

Der vorliegenden Erfindung liegt somit die Aufgabe zugrunde neue Verbindungen mit herbizider Wirkung bereitzustellen, die vorzugsweise eine höhere Wirksamkeit als die herbiziden Substanzen des 10 Standes der Technik und/oder eine bessere Selektivität gegenüber Schadpflanzen aufweisen.

Es wurde nun überraschenderweise gefunden, dass diese Aufgabe durch Pyrazolyl-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 15 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der nachstehend definierten, allgemeinen Formel I gelöst wird.

Demnach betrifft die vorliegende Erfindung Pyrazolyl-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen 20 der allgemeinen Formel I,



30

worin

X für N oder eine Gruppe C-R<sup>3</sup> steht;35 Y für O, S, SO, SO<sub>2</sub> oder NR<sup>4</sup> steht;

oder

X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet;

40

R<sup>1</sup> Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl, Aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

45

## 3

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, oder  
 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

5

R<sup>2</sup> Wasserstoff, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

R<sup>3</sup> Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Amino,  
 Mercapto, Rhodano, Hydrazid, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
 10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Aminoalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkoxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,

15 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino,  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkylamino, wobei die Alkyl- und  
 Cycloalkylgruppen der drei letztgenannten Reste teilweise  
 oder vollständig halogeniert und/oder ein, zwei oder drei  
 Substituenten, ausgewählt unter C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Hydroxy  
 20 tragen können,

C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylthio,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl,

25

Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl, Phenylamino, Phenoxy,  
 Diphenylamino, wobei die Phenyl- und Heterocyclylgruppen  
 der sechs letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder  
 vollständig halogeniert und/oder einen, zwei oder drei  
 30 Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können,

C(O)OR<sup>5</sup>, oder C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>;

35

R<sup>4</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

40

Phenyl, Naphthyl, wobei die zwei letztgenannten Reste  
 ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert und/oder  
 einen, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter  
 Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können;  
 bedeuten, wobei

45

## 4

R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

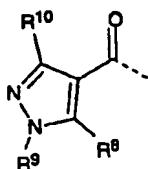
5 Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, wobei die drei  
letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig  
halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,  
ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
tragen können; und

10 R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

15 Phenyl oder Naphthyl stehen, wobei die zwei  
letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig  
halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,  
ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
20 tragen können;

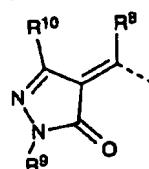
und P<sub>2</sub> für einen Rest der Formel IIa oder IIb steht,

25



30

IIa



IIb

worin die Variablen R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> folgende Bedeutung haben:

35 R<sup>8</sup> Hydroxy, Mercapto, Halogen, OR<sup>11</sup>, SR<sup>11</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>,  
OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, P(O)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, OP(O)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, P(S)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, OP(S)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>,  
NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, ONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup> oder N-gebundenes Heterocyclyl, das  
partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste  
tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

40

R<sup>9</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;

45

## 5

- R<sup>10</sup> Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio;
- 5 R<sup>11</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylcarbonyl,  
C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkylcarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthiocarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylaminocarbonyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylaminocarbonyl,  
N,N-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy)-aminocarbonyl,  
N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy)-aminocarbonyl,  
Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminothiocarbonyl oder  
20 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyimino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, wobei die genannten  
Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder  
vollständig halogeniert sein können und/oder eine,  
zwei oder drei der folgenden Gruppen tragen können:  
Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,  
25 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-aloxycarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylaminocarbonyl,  
Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, Aminocarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;  
30 Phenyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Phenylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl,  
Phenoxythiocarbonyl, Phenylaminocarbonyl,  
N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl,  
35 Phenyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenylcarbonyl, Heterocyclyl,  
Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
Heterocyclylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heterocyclylcarbonyl,  
Heterocycloloxy carbonyl, Heterocycloloxythiocarbonyl,  
Heterocyclaminocarbonyl,  
40 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-(heterocyclyl)-aminocarbonyl, oder  
Heterocyclyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenylcarbonyl, wobei der Phenyl-  
und der Heterocyclyl-Rest der 18 letztgenannten  
Substituenten partiell oder vollständig halogeniert  
sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden  
45 Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder

## 6

C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

- 5 R<sup>12</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, wobei die vier genannten Reste  
partiell oder vollständig halogeniert sein können  
und/oder eine, zwei oder drei der folgenden Gruppen  
tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxycarbonyl;

- 10 Phenyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heterocyclyl oder  
Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, wobei der Phenyl- und der  
Heterocyclyl-Rest der letztgenannten Substituenten  
partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste  
tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy  
oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl;

- 15 20 R<sup>13</sup>, R<sup>14</sup> unabhängig voneinander Wasserstoff, Hydroxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, Phenyl,  
Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl oder Phenoxy, wobei die drei  
letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig  
halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei  
der folgenden Reste tragen können: Nitro, Cyano,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl;

- 25 30 R<sup>15</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy,  
C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxy, Amino,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-amino oder  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonylamino, wobei die genannten Alkyl-,  
Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig  
halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei  
Reste der folgenden Gruppe tragen können: Cyano,  
C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylaminocarbonyl,  
Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-aminocarbonyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;

- 35 40 45 Phenyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Phenylcarbonyl,  
Heterocyclyl, Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl oder  
Heterocyclylcarbonyl, wobei der Phenyl- oder  
Heterocyclyl-Rest der sechs letztgenannten  
Substituenten partiell oder vollständig halogeniert

7

sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy; und

5

R<sup>16</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl; bedeutet,

sowie deren landwirtschaftlichen brauchbaren Salze.

10

Ferner wurden herbizide Mittel gefunden, die Pyrazolyl-Derivate der Formel I enthalten und eine sehr gute herbizide Wirkung besitzen. Außerdem wurden Verfahren zur Herstellung dieser Mittel und Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs mit 15 den Pyrazolylderivaten der Formel I gefunden.

Die Verbindungen der Formel I können je nach Substitutionsmuster ein oder mehrere Chiralitätszentren enthalten und liegen dann als Enantiomeren oder Diastereomerengemische vor. Gegenstand der Erfindung sind sowohl die reinen Enantiomeren oder Diastereomeren 20 als auch deren Gemische.

Die Verbindungen der Formel I können auch in Form ihrer landwirtschaftlich brauchbaren Salze vorliegen, wobei es auf die Art des 25 Salzes in der Regel nicht ankommt. Im allgemeinen kommen die Salze derjenigen Kationen oder die Säureadditionssalze derjenigen Säuren in Betracht, deren Kationen, beziehungsweise Anionen, die herbizide Wirkung der Verbindungen I nicht negativ beeinträchtigen.

30

Es kommen als Kationen insbesondere Ionen der Alkalimetalle, vorzugsweise Lithium, Natrium und Kalium, der Erdalkalimetalle, vorzugsweise Calcium und Magnesium, und der Übergangsmetalle, vorzugsweise Mangan, Kupfer, Zink und Eisen, sowie Ammonium, 35 wobei hier gewünschtenfalls ein bis vier Wasserstoffatome durch C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Hydroxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl, Phenyl oder Benzyl ersetzt sein können, vorzugsweise Ammonium, Dimethylammonium, Diisopropylammonium, Tetramethylammonium, Tetrabutylammonium, 40 2-(2-Hydroxyeth-1-oxy)eth-1-ylammonium, Di(2-hydroxyeth-1-yl)ammonium, Trimethylbenzylammonium, des weiteren Phosphoniumionen, Sulfoniumionen, vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfonium und Sulfoxoniumionen, vorzugsweise Tri(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)sulfoxonium, in Betracht.

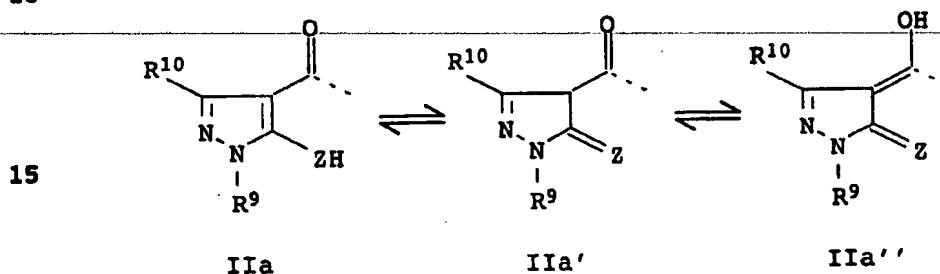
45

## 8

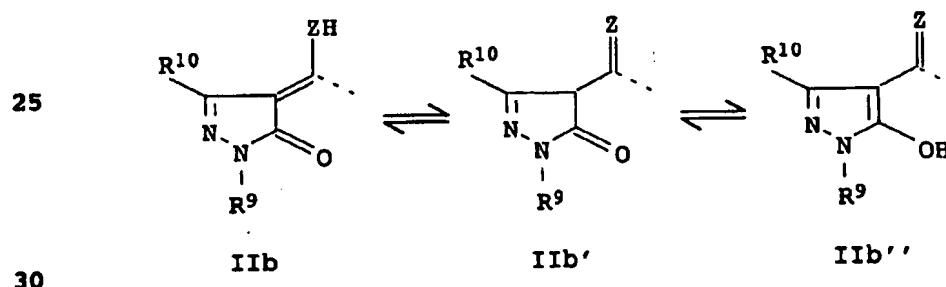
Anionen von brauchbaren Säureadditionsalzen sind in erster Linie Chlorid, Bromid, Fluorid, Hydrogensulfat, Sulfat, Dihydrogenphosphat, Hydrogenphosphat, Nitrat, Hydrogencarbonat, Carbonat, Hexafluorosilikat, Hexafluorophosphat, Benzoat sowie die Anionen von C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkansäuren, vorzugsweise Formiat, Acetat, Propionat und Butyrat.

Im Falle von R<sup>8</sup> = Hydroxy oder Mercapto {Z = O,S} steht IIa auch stellvertretend für die tautomeren Formen IIa' und IIa''

10



20 bzw. IIb auch stellvertretend für die tautomeren Formen IIb' und IIb''.



Die für die Substituenten R<sup>1</sup> bis R<sup>16</sup> oder als Reste an Phenyl- und Heterocyclyl-Resten genannten organischen Molekülteile stellen Sammelbegriffe für individuelle Aufzählungen der einzelnen 35 Gruppenmitglieder dar. Sämtliche Kohlenwasserstoffketten, also alle Alkyl-, Halogenalkyl-, Alkoxy-, Halogenalkoxy-, Alkylthio-, Halogenalkylthio-, Alkylsulfinyl-, Halogenalkylsulfinyl-, Alkylsulfonyl-, Halogenalkylsulfonyl-, N-Alkylamino-, N,N-Dialkylamino-, N-Halogenalkylamino-, N-Alkoxyamino-, 40 N-Alkoxy-N-alkylamino-, N-Alkylcarbonylamino-, Alkylcarbonyl-, Halogenalkylcarbonyl, Alkoxycarbonyl-, Halogenalkoxycarbonyl, Alkylthiocarbonyl-, Alkylcarbonyloxy-, Alkylaminocarbonyl-, Dialkylaminocarbonyl-, Dialkylaminothiocarbonyl-, Alkoxyalkyl-, Alkoxyiminoalkyl-, Phenylalkylcarbonyl, 45 Heterocyclalkylcarbonyl, Phenylalkenylcarbonyl-, Heterocyclalkenylcarbonyl-, N-Alkoxy-N-alkylaminocarbonyl-, N-Alkyl-N-phenylaminocarbonyl-,

N-Alkyl-N-heterocyclylaminocarbonyl-, Phenylalkyl-,  
 Heterocyclylalkyl-, Phenylcarbonylalkyl-,  
 Heterocyclylcarbonylalkyl-, Alkoxyalkoxycarbonyl-,  
 Alkenylcarbonyl-, Alkenyloxycarbonyl-, Alkenylaminocarbonyl-,  
 5 N-Alkenyl-N-alkylaminocarbonyl-,  
 N-Alkenyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, Alkinylcarbonyl-,  
 Alkinyloxycarbonyl-, Alkinylaminocarbonyl-,  
 N-Alkinyl-N-alkylaminocarbonyl-,  
 -N-Alkinyl-N-alkoxyaminocarbonyl-, Alkenyl-, Alkinyl-,  
 10 Halogenalkenyl-, Halogenalkinyl-, Alkenyloxy-, Alkinyloxy,  
Alkandiyl-, Alkendiyl-, Alkadieniyyl- oder Alkindiyyl- Teile können  
 geradkettig oder verzweigt sein. Sofern nicht anders angegeben  
 tragen halogenierte Substituenten vorzugsweise ein bis fünf  
 gleiche oder verschiedene Halogenatome. Die Bedeutung Halogen  
 15 steht jeweils für Fluor, Chlor, Brom oder Iod.

Ferner bedeuten beispielsweise:

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl: z.B. Methyl, Ethyl, Propyl, 1-Methylethyl, Butyl,  
 20 1-Methylpropyl, 2-Methylpropyl oder 1,1-Dimethylethyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, sowie die Alkylteile von C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino,  
 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino, N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino,  
 N(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
 25 N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
 (C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-phenylaminocarbonyl,  
 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-heterocyclylaminocarbonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, wie  
 voranstehend genannt, sowie z.B. Pentyl, 1-Methylbutyl,  
 30 2-Methylbutyl, 3-Methylbutyl, 2,2-Dimethylpropyl,  
 1-Ethylpropyl, Hexyl, 1,1-Dimethylpropyl, 1,2-Dimethylpropyl,  
 1-Methylpentyl, 2-Methylpentyl, 3-Methylpentyl,  
 4-Methylpentyl, 1,1-Dimethylbutyl, 1,2-Dimethylbutyl,  
 1,3-Dimethylbutyl, 2,2-Dimethylbutyl, 2,3-Dimethylbutyl,  
 35 3,3-Dimethylbutyl, 1-Ethylbutyl, 2-Ethylbutyl,  
 1,1,2-Trimethylpropyl, 1-Ethyl-1-methylpropyl oder  
 1-Ethyl-3-methylpropyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylrest, wie vorstehend  
 40 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,  
 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chlormethyl,  
 Dichlormethyl, Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl,  
 Trifluormethyl, Chlorfluormethyl, Dichlorfluormethyl,  
 Chlordifluormethyl, 2-Fluorethyl, 2-Chlorethyl, 2-Bromethyl,  
 45 2-Iodethyl, 2,2-Difluorethyl, 2,2,2-Trifluorethyl,  
 2-Chlor-2-fluorethyl, 2-Chlor-2,2-difluorethyl,  
 2,2-Dichlor-2-fluorethyl, 2,2,2-Trichlorethyl,

## 10

Pentafluorethyl, 2-Fluorpropyl, 3-Fluorpropyl,  
 2,2-Difluorpropyl, 2,3-Difluorpropyl, 2-Chlorpropyl,  
 3-Chlorpropyl, 2,3-Dichlorpropyl, 2-Brompropyl, 3-Brompropyl,  
 3,3,3-Trifluorpropyl, 3,3,3-Trichlorpropyl,  
 5 2,2,3,3,3-Pentafluorpropyl, Heptafluorpropyl,  
 1-(Fluormethyl)-2-fluorethyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethyl,  
 1-(Brommethyl)-2-bromethyl, 4-Fluorbutyl, 4-Chlorbutyl,  
 4-Brombutyl oder Nonafluorbutyl;

- 10 -  $C_1-C_6$ -Halogenalkyl, sowie die Halogenalkylteile von  
 $N-C_1-C_6$ -Halogenalkylamino:  $C_1-C_4$ -Halogenalkyl, wie  
 voranstehend genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentyl,  
 5-Chlorpentyl, 5-Brompentyl, 5-Ioppentyl, Undecafluorpentyl,  
 6-Fluorhexyl, 6-Chlorhexyl, 6-Bromhexyl, 6-Iodhexyl oder  
 15 Dodecafluorhexyl;
- $C_1-C_4$ -Alkoxy: z.B. Methoxy, Ethoxy, Propoxy, 1-Methylethoxy,  
 Butoxy, 1-Methylpropoxy, 2-Methylpropoxy oder  
 1,1-Dimethylethoxy;
- 20 -  $C_1-C_6$ -Alkoxy, sowie die Alkoxyteile von  $N-C_1-C_6$ -Alkoxyamino,  
 $N-(C_1-C_6\text{-Alkoxy})-N-(C_1-C_6\text{-alkyl})$ amino,  
 $C_1-C_6$ -Alkoxyimino- $C_1-C_6$ -alkyl,  
 $N-(C_1-C_6\text{-Alkoxy})-N-(C_1-C_6\text{-alkyl})$ -aminocarbonyl,  
 25  $N-(C_3-C_6\text{-Alkenyl})-N-(C_1-C_6\text{-alkoxy})$ -aminocarbonyl und  
 $N-(C_3-C_6\text{-Alkinyl})-N-(C_1-C_6\text{-alkoxy})$ -aminocarbonyl:  
 $C_1-C_4$ -Alkoxy, wie voranstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy,  
 1-Methylbutoxy, 2-Methylbutoxy, 3-Methylbutoxy,  
 1,1-Dimethylpropoxy, 1,2-Dimethylpropoxy,
- 30 2,2-Dimethylpropoxy, 1-Ethylpropoxy, Hexoxy, 1-Methylpentoxy,  
 2-Methylpentoxy, 3-Methylpentoxy, 4-Methylpentoxy,  
 1,1-Dimethylbutoxy, 1,2-Dimethylbutoxy, 1,3-Dimethylbutoxy,  
 2,2-Dimethylbutoxy, 2,3-Dimethylbutoxy, 3,3-Dimethylbutoxy,  
 1-Ethylbutoxy, 2-Ethylbutoxy, 1,1,2-Trimethylpropoxy,
- 35 1,2,2-Trimethylpropoxy, 1-Ethyl-1-methylpropoxy oder  
 1-Ethyl-2-methylpropoxy;
- $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy: einen  $C_1-C_4$ -Alkoxyrest, wie voranstehend  
 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,  
 40 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethoxy,  
 Difluormethoxy, Trifluormethoxy, Chlordifluormethoxy,  
 Bromdifluormethoxy, 2-Fluorethoxy, 2-Chlorethoxy,  
 2-Brommethoxy, 2-Iodethoxy, 2,2-Difluorethoxy,  
 2,2,2-Trifluorethoxy, 2-Chlor-2-fluorethoxy,  
 45 2-Chlor-2,2-difluorethoxy, 2,2-Di-chlor-2-fluorethoxy,  
 2,2,2-Trichlorethoxy, Pentafluorethoxy, 2-Fluorpropoxy,  
 3-Fluorpropoxy, 2-Chlorpropoxy, 3-Chlorpropoxy,

## 11

- 2-Brompropoxy, 3-Brompropoxy, 2,2-Difluorpropoxy,  
 2,3-Difluorpropoxy, 2,3-Dichlorpropoxy,  
 3,3,3-Trifluorpropoxy, 3,3,3-Trichlorpropoxy,  
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxy, Heptafluorpropoxy,  
 5 1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxy, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxy,  
 1-(Brommethyl)-2-bromethoxy, 4-Fluorbutoxy, 4-Chlorbutoxy,  
 4-Brombutoxy oder Nonafluorbutoxy;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, wie voranstehend  
 10 genannt, sowie z.B. 5-Fluorpentoxy, 5-Chlorpentoxy,  
5-Brompenoxy, 5-Iodpenoxy, Undecafluorpenoxy,  
6-Fluorhexoxy, 6-Chlorhexoxy, 6-Bromhexoxy, 6-Iodhexoxy oder  
Dodecafluorhexoxy;
- 15 — C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfanyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-S-): z.B.  
 Methylthio, Ethylthio, Propylthio, 1-Methylethylthio,  
 Butylthio, 1-Methylpropylthio, 2-Methylpropylthio oder  
 1,1-Dimethylethylthio;
- 20 — C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, sowie die Alkylthioeteile von  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthiocarbonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, wie voranstehend  
 genannt, sowie z.B. Pentyllthio, 1-Methylbutylthio,  
 2-Methylbutylthio, 3-Methylbutylthio, 2,2-Dimethylpropylthio,  
 1-Ethylpropylthio, Hexylthio, 1,1-Dimethylpropylthio,  
 25 1,2-Dimethylpropylthio, 1-Methylpentylthio,  
 2-Methylpentylthio, 3-Methylpentylthio, 4-Methylpentylthio,  
 1,1-Dimethylbutylthio, 1,2-Dimethylbutylthio,  
 1,3-Dimethylbutylthio, 2,2-Dimethylbutylthio,  
 2,3-Dimethylbutylthio, 3,3-Dimethylbutylthio,  
 30 1-Ethylbutylthio, 2-Ethylbutylthio,  
 1,1,2-Trimethylpropylthio, 1,2,2-Trimethylpropylthio,  
 1-Ethyl-1-methylpropylthio oder 1-Ethyl-2-methylpropylthio;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthiorest, wie  
 35 voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch  
 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.  
 Fluormethylthio, Difluormethylthio, Trifluormethylthio,  
 Chlordifluormethylthio, Bromdifluormethylthio,  
 2-Fluorethylthio, 2-Chlorethylthio, 2-Bromethylthio,  
 40 2-Iodethylthio, 2,2-Difluorethylthio,  
 2,2,2-Trifluorethylthio, 2,2,2-Trichlorethylthio,  
 2-Chlor-2-fluorethylthio, 2-Chlor-2,2-difluorethylthio,  
 2,2-Dichlor-2-fluorethylthio, Pentafluorethylthio,  
 2-Fluorpropylthio, 3-Fluorpropylthio, 2-Chlorpropylthio,  
 45 3-Chlorpropylthio, 2-Brompropylthio, 3-Brompropylthio,  
 2,2-Difluorpropylthio, 2,3-Difluorpropylthio,  
 2,3-Dichlorpropylthio, 3,3,3-Trifluorpropylthio,

## 12

- 3,3,3-Tri-chlorpropylthio, 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylthio,  
 Heptafluorpropylthio, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylthio,  
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylthio,  
 1-(Brommethyl)-2-bromethylthio, 4-Fluorbutylthio,  
 5 4-Chlorbutylthio, 4-Brombutylthio oder Nonafluorbutylthio;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, wie vorstehend  
 genannt, sowie 5-Fluorpentylthio, 5-Chlorpentylthio,  
 10 5-Brompentylthio, 5-Iodpentylthio, Undecafluorpentylthio,  
 6-Fluorhexylthio, 6-Chlorhexylthio, 6-Bromhexylthio,  
 6-Iodhexylthio oder Dodecafluorhexylthio;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-S(=O)-): z.B. Methylsulfinyl,  
 15 Ethylsulfinyl, Propylsulfinyl, 1-Methylethylsulfinyl,  
 Butylsulfinyl, 1-Methylpropylsulfinyl, 2-Methylpropylsulfinyl  
 oder 1,1-Dimethylethylsulfinyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinyl, wie vorstehend  
 genannt, sowie Pentylsulfinyl, 1-Methylbutylsulfinyl,  
 20 2-Methylbutylsulfinyl, 3-Methylbutylsulfinyl,  
 2,2-Dimethylpropylsulfinyl, 1-Ethylpropylsulfinyl,  
 1,1-Dimethylpropylsulfinyl, 1,2-Dimethylpropylsulfinyl,  
 Hexylsulfinyl, 1-Methylpentylsulfinyl,  
 2-Methylpentylsulfinyl, 3-Methylpentylsulfinyl,  
 25 4-Methylpentylsulfinyl, 1,1-Dimethylbutylsulfinyl,  
 1,2-Dimethylbutylsulfinyl, 1,3-Dimethylbutylsulfinyl,  
 2,2-Dimethylbutylsulfinyl, 2,3-Dimethylbutylsulfinyl,  
 3,3-Dimethylbutylsulfinyl, 1-Ethylbutylsulfinyl,  
 2-Ethylbutylsulfinyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfinyl,  
 30 1,2,2-Trimethylpropylsulfinyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfinyl  
 oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfinyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfinylrest, wie  
 voranstehtend genannt, der partiell oder vollständig durch  
 35 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.  
 Fluormethylsulfinyl, Difluormethylsulfinyl,  
 Trifluormethylsulfinyl, Chlordifluormethylsulfinyl,  
 Bromdifluormethylsulfinyl, 2-Fluorethylsulfinyl,  
 2-Chlorethylsulfinyl, 2-Bromethylsulfinyl,  
 40 2-Iodethylsulfinyl, 2,2-Difluorethylsulfinyl,  
 2,2,2-Trifluorethylsulfinyl, 2,2,2-Trichlorethylsulfinyl,  
 2-Chlor-2-fluorethylsulfinyl,  
 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfinyl,  
 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfinyl, Pentafluorethylsulfinyl,  
 45 2-Fluorpropylsulfinyl, 3-Fluorpropylsulfinyl,  
 2-Chlorpropylsulfinyl, 3-Chlorpropylsulfinyl,  
 2-Brompropylsulfinyl, 3-Brompropylsulfinyl,

13

- 2,2-Difluorpropylsulfinyl, 2,3-Difluorpropylsulfinyl,  
 2,3-Dichlorpropylsulfinyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfinyl,  
 3,3,3-Trichlorpropylsulfinyl,  
 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfinyl, Heptafluorpropylsulfinyl,  
 5 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfinyl,  
 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfinyl,  
 1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfinyl, 4-Fluorbutylsulfinyl,  
 4-Chlorbutylsulfinyl, 4-Brombutylsulfinyl oder  
 Nonafuorbutylsulfinyl;
- 10 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfinyl, wie vorstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylsulfinyl,  
 5-Chlorpentylsulfinyl, 5-Brompentylsulfinyl,  
 5-Iodpentylsulfinyl, Undecafluorpentylsulfinyl,  
 15 6-Fluorhexylsulfinyl, 6-Chlorhexylsulfinyl,  
 6-Bromhexylsulfinyl, 6-Iodhexylsulfinyl oder Dodecafluorhexylsulfinyl;
- 20 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl-S(=O)<sub>2</sub>-) z.B. Methylsulfonyl,  
 Ethylsulfonyl, Propylsulfonyl, 1-Methylethylsulfonyl,  
 Butylsulfonyl, 1-Methylpropylsulfonyl, 2-Methylpropylsulfonyl oder 1,1-Dimethylethylsulfonyl;
- 25 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonyl, wie vorstehend genannt, sowie Pentylsulfonyl, 1-Methylbutylsulfonyl,  
 2-Methylbutylsulfonyl, 3-Methylbutylsulfonyl,  
 1,1-Dimethylpropylsulfonyl, 1,2-Dimethylpropylsulfonyl,  
 2,2-Dimethylpropylsulfonyl, 1-Ethylpropylsulfonyl,  
 Hexylsulfonyl, 1-Methylpentylsulfonyl,  
 30 2-Methylpentylsulfonyl, 3-Methylpentylsulfonyl,  
 4-Methylpentylsulfonyl, 1,1-Dimethylbutylsulfonyl,  
 1,2-Dimethylbutylsulfonyl, 1,3-Dimethylbutylsulfonyl,  
 2,2-Dimethylbutylsulfonyl, 2,3-Dimethylbutylsulfonyl,  
 3,3-Dimethylbutylsulfonyl, 1-Ethylbutylsulfonyl,  
 35 2-Ethylbutylsulfonyl, 1,1,2-Trimethylpropylsulfonyl,  
 1,2,2-Trimethylpropylsulfonyl, 1-Ethyl-1-methylpropylsulfonyl oder 1-Ethyl-2-methylpropylsulfonyl;
- 40 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylsulfonylrest, wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Fluormethylsulfonyl, Difluormethylsulfonyl, Trifluormethylsulfonyl, Chlordifluormethylsulfonyl, Bromdifluormethylsulfonyl, 2-Fluorethylsulfonyl,  
 45 2-Chlorethylsulfonyl, 2-Bromethylsulfonyl,  
 2-Iodethylsulfonyl, 2,2-Difluorethylsulfonyl,  
 2,2,2-Trifluorethylsulfonyl, 2-Chlor-2-fluorethylsulfonyl,

## 14

- 2-Chlor-2,2-difluorethylsulfonyl,  
 2,2-Dichlor-2-fluorethylsulfonyl,  
 2,2,2-Trichlorethylsulfonyl, Pentafluorethylsulfonyl,  
 2-Fluorpropylsulfonyl, 3-Fluorpropylsulfonyl,  
 5 2-Chlorpropylsulfonyl, 3-Chlorpropylsulfonyl,  
 2-Brompropylsulfonyl, 3-Brompropylsulfonyl,  
 2,2-Difluorpropylsulfonyl, 2,3-Difluorpropylsulfonyl,  
 2,3-Dichlorpropylsulfonyl, 3,3,3-Trifluorpropylsulfonyl,  
 3,3,3-Trichlorpropylsulfonyl,  
 10 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylsulfonyl, Heptafluorpropylsulfonyl,  
1-(Fluormethyl)-2-fluorethylsulfonyl,  
1-(Chlormethyl)-2-chlorethylsulfonyl,  
1-(Brommethyl)-2-bromethylsulfonyl, 4-Fluorbutylsulfonyl,  
4-Chlorbutylsulfonyl, 4-Brombutylsulfonyl oder  
 15 Nonafluorbutylsulfonyl;  
  - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkysulfonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylsulfonyl, wie vorstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylsulfonyl,  
 5-Chlorpentylsulfonyl, 5-Brompentylsulfonyl,  
 20 5-Iodpentylsulfonyl, 6-Fluorhexylsulfonyl,  
 6-Bromhexylsulfonyl, 6-Iodhexylsulfonyl oder Dodecafluorhexylsulfonyl;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino: Methylamino, Ethylamino, Propylamino,  
 25 1-Methylethylamino, Butylamino, 1-Methylpropylamino,  
 2-Methylpropylamino, 1,1-Dimethylethylamino, Pentylamino,  
 1-Methylbutylamino, 2-Methylbutylamino, 3-Methylbutylamino,  
 2,2-Dimethylpropylamino, 1-Ethylpropylamino, Hexylamino,  
 1,1-Dimethylpropylamino, 1,2-Dimethylpropylamino,  
 30 1-Methylpentylamino, 2-Methylpentylamino,  
 3-Methylpentylamino, 4-Methylpentylamino,  
 1,1-Dimethylbutylamino, 1,2-Dimethylbutylamino,  
 1,3-Dimethylbutylamino, 2,2-Dimethylbutylamino,  
 2,3-Dimethylbutylamino, 3,3-Dimethylbutylamino,  
 35 1-Ethylbutylamino, 2-Ethylbutylamino,  
 1,1,2-Trimethylpropylamino, 1,2,2-Trimethylpropylamino,  
 1-Ethyl-1-methylpropylamino oder 1-Ethyl-2-methylpropylamino;
  - Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino, also z.B. N,N-Dimethylamino,  
 40 N,N-Di-ethylamino, N,N-Dipropylamino,  
 N,N-Di-(1-methylethyl)amino, N,N-Dibutylamino,  
 N,N-Di-(1-methylpropyl)amino, N,N-Di-(2-methylpropyl)amino,  
 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)amino, N-Ethyl-N-methylamino,  
 N-Methyl-N-propylamino, N-Methyl-N-(1-methylethyl)amino,  
 45 N-Butyl-N-methylamino, N-Methyl-N-(1-methylpropyl)amino,  
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)amino,  
 N-(1,1-Di-methylethyl)-N-methylamino, N-Ethyl-N-propylamino,

## 15

- N-Ethyl-N-(1-methylethyl)amino, N-Butyl-N-ethylamino,  
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)amino,  
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)amino,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,  
 5 N-(1-Methylethyl)-N-propylamino, N-Butyl-N-propylamino,  
 N-(1-Methylpropyl)-N-propylamino,  
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylamino,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylamino,  
 N-Butyl-N-(1-methylethyl)amino,  
 10 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)amino,  
 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)amino,  
 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-amino,  
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)amino,  
 15 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)amino,  
 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-amino,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-amino oder  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)amino;  
 20 - Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino: Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)amino wie voranstehend  
 genannt, sowie N,N-Dipentylamino, N,N-Dihexylamino,  
 N-Methyl-N-pentylamino, N-Ethyl-N-pentylamino,  
 N-Methyl-N-hexylamino oder N-Ethyl-N-hexylamino;  
 25 - C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl: z.B. Methylcarbonyl, Ethylcarbonyl,  
 Propylcarbonyl, 1-Methylethylcarbonyl, Butylcarbonyl,  
 1-Methylpropylcarbonyl, 2-Methylpropylcarbonyl oder  
 1,1-Dimethylethylcarbonyl;  
 30 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, sowie die Alkylcarbonylreste von  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonylamino:  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, wie voranstehend genannt, sowie z.B.  
 Pentylcarbonyl, 1-Methylbutylcarbonyl, 2-Methylbutylcarbonyl,  
 3-Methylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylpropylcarbonyl,  
 35 1-Ethylpropylcarbonyl, Hexylcarbonyl,  
 1,1-Dimethylpropylcarbonyl, 1,2-Dimethylpropylcarbonyl,  
 1-Methylpentylcarbonyl, 2-Methylpentylcarbonyl,  
 3-Methylpentylcarbonyl, 4-Methylpentylcarbonyl,  
 1,1-Dimethylbutylcarbonyl, 1,2-Dimethylbutylcarbonyl,  
 40 1,3-Dimethylbutylcarbonyl, 2,2-Dimethylbutylcarbonyl,  
 2,3-Dimethylbutylcarbonyl, 3,3-Dimethylbutylcarbonyl,  
 1-Ethylbutylcarbonyl, 2-Ethylbutylcarbonyl,  
 1,1,2-Trimethylpropylcarbonyl, 1,2,2-Trimethylpropylcarbonyl,  
 1-Ethyl-1-methylpropylcarbonyl oder  
 45 1-Ethyl-2-methylpropylcarbonyl;

## 16

- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylcarbonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonylrest, wie vorstehend genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. Chloracetyl, Dichloracetyl, Trichloracetyl, Fluoracetyl,  
 5 Difluoracetyl, Trifluoracetyl, Chlorfluoracetyl, Dichlor-fluoracetyl, Chlordifluoracetyl, 2-Fluorethylcarbonyl, 2-Chlorethylcarbonyl, 2-Bromethylcarbonyl, 2-Iodethylcarbonyl, 2,2-Difluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trifluorethylcarbonyl,  
 10 2-Chlor-2-fluorethylcarbonyl, 2-Chlor-2,2-difluorethylcarbonyl, 2,2-Dichlor-2-fluorethylcarbonyl, 2,2,2-Trichlorethylcarbonyl, Pentafluorethylcarbonyl, 2-Fluorpropylcarbonyl, 3-Fluorpropylcarbonyl,  
 15 2,2-Difluorpropylcarbonyl, 2,3-Di-fluorpropylcarbonyl, 2-Chlorpropylcarbonyl, 3-Chlorpropylcarbonyl, 2,3-Dichlorpropylcarbonyl, 2-Brompropylcarbonyl, 3-Brompropylcarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropylcarbonyl, 3,3,3-Trichlorpropylcarbonyl,  
 20 2,2,3,3,3-Pentafluorpropylcarbonyl, Heptafluorpropylcarbonyl, 1-(Fluormethyl)-2-fluorethylcarbonyl, 1-(Chlormethyl)-2-chlorethylcarbonyl, 1-(Brommethyl)-2-bromethylcarbonyl, 4-Fluorbutylcarbonyl,  
 25 4-Chlorbutylcarbonyl, 4-Brombutylcarbonyl oder Nonafuorbutylcarbonyl;
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylcarbonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylcarbonylrest wie voranstehend genannt, sowie 5-Fluorpentylcarbonyl, 5-Chlorpentylcarbonyl,  
 30 5-Brompentylcarbonyl, Perfluorpentylcarbonyl, 6-Fluorhexylcarbonyl, 6-Chlorhexylcarbonyl, 6-Bromhexylcarbonyl oder Perfluorhexylcarbonyl;
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl also z.B. Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Propoxycarbonyl, 1-Methylethoxycarbonyl, Butoxycarbonyl, 1-Methylpropoxycarbonyl, 2-Methylpropoxycarbonyl oder 1,1-Dimethylethoxycarbonyl;  
 35
  
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxycarbonyl: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl, wie vorstehend genannt, sowie z.B. Pentoxy carbonyl, 1-Methylbutoxycarbonyl, 2-Methylbutoxycarbonyl, 3-Methylbutoxycarbonyl, 2,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Ethylpropoxycarbonyl, Hexoxycarbonyl, 1,1-Dimethylpropoxycarbonyl, 1,2-Dimethylpropoxycarbonyl, 1-Methylpentoxycarbonyl,  
 40 2-Methylpentoxycarbonyl, 3-Methylpentoxycarbonyl, 4-Methylpentoxycarbonyl, 1,1-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 1,3-Dimethylbutoxycarbonyl,
  
- 45

17

- 2,2-Dimethylbutoxycarbonyl, 2,3-Dimethylbutoxycarbonyl,  
 3,3-Dimethylbutoxycarbonyl, 1-Ethylbutoxycarbonyl,  
 2-Ethylbutoxycarbonyl, 1,1,2-Trimethylpropoxycarbonyl,  
 1,2,2-Trimethylpropoxycarbonyl,  
 5 1-Ethyl-1-methyl-propoxycarbonyl oder  
 1-Ethyl-2-methyl-propoxycarbonyl;
- 
- C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxycarbonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy carbonylrest,  
 wie voranstehend genannt, der partiell oder vollständig durch  
 10 Fluor, Chlor, Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.  
Fluormethoxycarbonyl, Difluormethoxycarbonyl,  
Trifluormethoxycarbonyl, Chlordifluormethoxycarbonyl,  
Bromdifluormethoxycarbonyl, 2-Fluorethoxycarbonyl,  
2-Chlorethoxycarbonyl, 2-Bromethoxycarbonyl,  
 15 2-Iodethoxycarbonyl, 2,2-Difluorethoxycarbonyl,  
2,2,2-Trifluorethoxycarbonyl, 2-Chlor-2-fluorethoxycarbonyl,  
2-Chlor-2,2-difluorethoxycarbonyl,  
2,2-Dichlor-2-fluorethoxycarbonyl,  
2,2,2-Trichlorethoxycarbonyl, Pentafluorethoxycarbonyl,  
 20 2-Fluorpropoxycarbonyl, 3-Fluorpropoxycarbonyl,  
2-Chlorpropoxycarbonyl, 3-Chlorpropoxycarbonyl,  
2-Brompropoxycarbonyl, 3-Brompropoxycarbonyl,  
2,2-Difluorpropoxycarbonyl, 2,3-Difluorpropoxycarbonyl,  
2,3-Dichlorpropoxycarbonyl, 3,3,3-Trifluorpropoxycarbonyl,  
 25 3,3,3-Trichlorpropoxycarbonyl,  
2,2,3,3,3-Pentafluorpropoxycarbonyl,  
Heptafluorpropoxycarbonyl,  
1-(Fluormethyl)-2-fluorethoxycarbonyl,  
1-(Chlormethyl)-2-chlorethoxycarbonyl,  
 30 1-(Brommethyl)-2-bromethoxycarbonyl, 4-Fluorbutoxycarbonyl,  
4-Chlorbutoxycarbonyl, 4-Brombutoxycarbonyl oder  
4-Iodbutoxycarbonyl;
- 
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenoxycarbonyl: einen C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenoxycarbonylrest  
 wie voranstehend genannt, sowie 5-Fluorpentoxycarbonyl,  
 35 5-Chlorpentoxycarbonyl, 5-Brompentoxycarbonyl,  
 6-Fluorhexoxycarbonyl, 6-Chlorhexoxycarbonyl oder  
 6-Bromhexoxycarbonyl;
- 
- 40 - (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl)carbonyloxy: Acetyloxy, Ethylcarbonyloxy,  
 Propylcarbonyloxy, 1-Methylethylcarbonyloxy,  
 Butylcarbonyloxy, 1-Methylpropylcarbonyloxy,  
 2-Methylpropylcarbonyloxy oder 1,1-Dimethylethylcarbonyloxy;
- 
- 45 - (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino)carbonyl: z.B. Methylaminocarbonyl,  
 Ethylaminocarbonyl, Propylaminocarbonyl,  
 1-Methylethylaminocarbonyl, Butylaminocarbonyl,

## 18

- 1-Methylpropylaminocarbonyl, 2-Methylpropylaminocarbonyl oder  
 1,1-Dimethylethylaminocarbonyl;
- (C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino)carbonyl: (C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylamino)carbonyl, wie  
 vorstehend genannt, sowie z.B. Pentylaminocarbonyl,  
 5 1-Methylbutylaminocarbonyl, 2-Methylbutylaminocarbonyl,  
 3-Methylbutylaminocarbonyl, 2,2-Dimethylpropylaminocarbonyl,  
 1-Ethylpropylaminocarbonyl, Hexylaminocarbonyl,  
 1,1-Dimethylpropylaminocarbonyl,  
 10 1,2-Dimethylpropylaminocarbonyl, 1-Methylpentylaminocarbonyl,  
2-Methylpentylaminocarbonyl, 3-Methylpentylaminocarbonyl,  
 4-Methylpentylaminocarbonyl, 1,1-Dimethylbutylaminocarbonyl,  
 1,2-Dimethylbutylaminocarbonyl,  
 1,3-Dimethylbutylaminocarbonyl,  
 15 2,2-Dimethylbutylaminocarbonyl,  
 2,3-Dimethylbutylaminocarbonyl,  
 3,3-Dimethylbutylaminocarbonyl, 1-Ethylbutylaminocarbonyl,  
 2-Ethylbutylaminocarbonyl,  
 1,1,2-Trimethylpropylaminocarbonyl,  
 20 1,2,2-Trimethylpropylaminocarbonyl,  
 1-Ethyl-1-methylpropylaminocarbonyl oder  
 1-Ethyl-2-methylpropylaminocarbonyl;
- Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-aminocarbonyl: z.B.  
 25 N,N-Dimethylaminocarbonyl, N,N-Diethylaminocarbonyl,  
 N,N-Di-(1-methylethyl)aminocarbonyl,  
 N,N-Dipropylaminocarbonyl, N,N-Dibutylaminocarbonyl,  
 N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 30 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-methylaminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-propylaminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-methylaminocarbonyl,  
 35 N-Methyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-propylaminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,  
 40 N-Butyl-N-ethylaminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-propylaminocarbonyl,  
 45 N-Butyl-N-propylaminocarbonyl,  
 N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,  
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminocarbonyl,

## 19

N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 5 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminocarbonyl,  
 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 10 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminocarbonyl oder  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminocarbonyl;

- Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl:  
 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, wie voranstehend genannt,  
 15 sowie z.B. N-Methyl-N-pentylaminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 20 N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-hexylaminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 25 N-Methyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 30 N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 35 N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 40 N-Ethyl-N-pentylaminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 45 N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-hexylaminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,

## 20

- N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 5 N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 10 N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 15 N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminocarbonyl,  
 N-Propyl-N-pentylaminocarbonyl,  
 N-Butyl-N-pentylaminocarbonyl, N,N-Dipentylaminocarbonyl,  
 20 N-Propyl-N-hexylaminocarbonyl, N-Butyl-N-hexylaminocarbonyl,  
 N-Pentyl-N-hexylaminocarbonyl oder N,N-Dihexylaminocarbonyl;
- Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminothiocarbonyl: z.B.  
 25 N,N-Dimethylaminothiocarbonyl, N,N-Diethylaminothiocarbonyl,  
 N,N-Di-(1-methylethyl)aminothiocarbonyl,  
 N,N-Dipropylaminothiocarbonyl, N,N-Dibutylaminothiocarbonyl,  
 N,N-Di-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N,N-Di-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N,N-Di-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 30 N-Ethyl-N-methylaminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-propylaminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-methylaminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 35 N-Methyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-methylaminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-propylaminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-ethylaminothiocarbonyl,  
 40 N-Ethyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-propylaminothiocarbonyl,  
 45 N-(1-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl,  
 N-(2-Methylpropyl)-N-propylaminothiocarbonyl,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-propylaminothiocarbonyl,

## 21

- N-Butyl-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1-Methylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 5 N-Butyl-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-(1,1-dimethylethyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1-Methylpropyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 10 N-(1,1-Dimethylethyl)-N-(2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-pentylaminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 15 N-Methyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-hexylaminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 20 N-Methyl-N-(1-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(4-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 25 N-Methyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 30 N-Methyl-N-(1-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(2-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Methyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 35 N-Methyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-pentylaminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3-methylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 40 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-hexylaminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 45 N-Ethyl-N-(1-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,

## 22

- N-Ethyl-N-(4-methylpentyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,1-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 5 N-Ethyl-N-(2,2-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(3,3-dimethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(2-ethylbutyl)-aminothiocarbonyl,  
 10 N-Ethyl-N-(1,1,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1,2,2-trimethylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-1-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Ethyl-N-(1-ethyl-2-methylpropyl)-aminothiocarbonyl,  
 N-Propyl-N-pentylaminothiocarbonyl,  
 15 N-Butyl-N-pentylaminothiocarbonyl,  
 N,N-Dipentylaminothiocarbonyl,  
 N-Propyl-N-hexylaminothiocarbonyl,  
 N-Butyl-N-hexylaminothiocarbonyl,  
 N-Pentyl-N-hexylaminothiocarbonyl oder  
 20 N,N-Dihexylaminothiocarbonyl;
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl: durch ein bis drei OH-Gruppen substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, z.B. Hydroxymethyl, 1-Hydroxyethyl, 2-Hydroxyethyl, 1,2-Bishydroxyethyl, 1-Hydroxypropyl, 2-Hydroxypropyl, 3-Hydroxypropyl, 4-Hydroxybutyl, 2,2-Dimethyl-3-hydroxypropyl;
  - Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl: durch einen Phenylrest substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, z.B. Benzyl, 1-Phenylethyl und 2-Phenylethyl, wobei der Phenylrest in der angegebenen Weise teilweise oder vollständig halogeniert sein kann oder einen bis drei der für Phenyl oben angegebenen Substituenten aufweisen kann; Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl steht dementsprechend für ein durch einen Heterocyclrest substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;
  - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl: durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, wie vorstehend genannt, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, also z.B. Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Propoxymethyl, (1-Methylethoxy)methyl, Butoxymethyl, (1-Methylpropoxy)methyl,
  - (2-Methylpropoxy)-methyl, (1,1-Dimethylethoxy)methyl, 2-(Methoxy)ethyl, 2-(Ethoxy)ethyl, 2-(Propoxy)ethyl, 2-(1-Methylethoxy)ethyl, 2-(Butoxy)ethyl, 2-(1-Methylpropoxy)ethyl, 2-(2-Methylpropoxy)ethyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethyl, 2-(Methoxy)-propyl, 2-(Ethoxy)propyl, 2-(Propoxy)propyl, 2-(1-Methylethoxy)-propyl, 2-(Butoxy)propyl, 2-(1-Methylpropoxy)propyl, 2-(2-Methylpropoxy)propyl,

## 23

- 2-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 3-(Methoxy)propyl,  
 3-(Ethoxy)-propyl, 3-(Propoxy)propyl,  
 3-(1-Methylethoxy)propyl, 3-(Butoxy)propyl,  
 3-(1-Methylpropoxy)propyl, 3-(2-Methylpropoxy)propyl,  
 5      3-(1,1-Dimethylethoxy)propyl, 2-(Methoxy)butyl,  
 2-(Ethoxy)butyl, 2-(Propoxy)butyl, 2-(1-Methylethoxy)butyl,  
 2-(Butoxy)butyl, 2-(1-Methylpropoxy)butyl,  
 2-(2-Methylpropoxy)butyl, 2-(1,1-Dimethylethoxy)butyl,  
 3-(Methoxy)butyl, 3-(Ethoxy)butyl, 3-(Propoxy)butyl,  
 10     3-(1-Methylethoxy)butyl, 3-(Butoxy)-butyl,  
 3-(1-Methylpropoxy)butyl, 3-(2-Methylpropoxy)butyl,  
 3-(1,1-Dimethylethoxy)butyl, 4-(Methoxy)butyl,  
 4-(Ethoxy)-butyl, 4-(Propoxy)butyl, 4-(1-Methylethoxy)butyl,  
 4-(Butoxy)-butyl, 4-(1-Methylpropoxy)butyl,  
 15     4-(2-Methylpropoxy)butyl oder 4-(1,1-Dimethylethoxy)butyl;  
  
 - C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, sowie die Alkoxyalkoxyteile von  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxycarbonyl: durch C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, wie  
 vorstehend genannt, substituiertes C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, also z.B. für  
 20     Methoxymethoxy, Ethoxymethoxy, Propoxymethoxy,  
 (1-Methylethoxy)methoxy, Butoxymethoxy,  
 (1-Methylpropoxy)methoxy, (2-Methylpropoxy)methoxy,  
 (1,1-Dimethylethoxy)methoxy, 2-(Methoxy)ethoxy,  
 2-(Ethoxy)ethoxy, 2-(Propoxy)ethoxy,  
 25     2-(1-Methylethoxy)ethoxy, 2-(Butoxy)ethoxy,  
 2-(1-Methylpropoxy)ethoxy, 2-(2-Methylpropoxy)ethoxy,  
 2-(1,1-Dimethylethoxy)ethoxy, 2-(Methoxy)propoxy,  
 2-(Ethoxy)propoxy, 2-(Propoxy)propoxy,  
 2-(1-Methylethoxy)propoxy, 2-(Butoxy)-propoxy,  
 30     2-(1-Methylpropoxy)propoxy, 2-(2-Methylpropoxy)propoxy,  
 2-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 3-(Methoxy)-propoxy,  
 3-(Ethoxy)propoxy, 3-(Propoxy)propoxy,  
 3-(1-Methylethoxy)propoxy, 3-(Butoxy)propoxy,  
 3-(1-Methylpropoxy)-propoxy, 3-(2-Methylpropoxy)propoxy,  
 35     3-(1,1-Dimethylethoxy)propoxy, 2-(Methoxy)butoxy,  
 2-(Ethoxy)butoxy, 2-(Propoxy)butoxy,  
 2-(1-Methylethoxy)butoxy, 2-(Butoxy)-butoxy,  
 2-(1-Methylpropoxy)butoxy, 2-(2-Methylpropoxy)butoxy,  
 2-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 3-(Methoxy)butoxy,  
 40     3-(Ethoxy)-butoxy, 3-(Propoxy)butoxy,  
 3-(1-Methylethoxy)butoxy, 3-(Butoxy)butoxy,  
 3-(1-Methylpropoxy)butoxy, 3-(2-Methylpropoxy)butoxy,  
 3-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy, 4-(Methoxy)-butoxy,  
 4-(Ethoxy)butoxy, 4-(Propoxy)butoxy,  
 45     4-(1-Methylethoxy)butoxy, 4-(Butoxy)butoxy,

## 24

- 4-(1-Methylpropoxy)butoxy, 4-(2-Methylpropoxy)butoxy oder  
4-(1,1-Dimethylethoxy)butoxy;
- $C_1\text{-}C_6\text{-Alkylcarbonyl-C}_1\text{-}C_6\text{-alkyl}$ : Durch eine  
5  $C_1\text{-}C_6\text{-Alkylcarbonylgruppe substituiertes } C_1\text{-}C_6\text{-Alkyl}$ , worin  
beide der  $C_1\text{-}C_6\text{-Alkylgruppen ein oder mehrere Substituenten}$ ,  
ausgewählt unter  $C_1\text{-}C_4\text{-Alkoxy und/oder Hydroxy aufweisen}$   
können: z.B. Acetilmethyl (=2-Oxopropyl), 2-(Acetyl)ethyl  
(=3-Oxo-n-butyl), 3-Oxo-n-pentyl, 1,1-Dimethyl-2-oxopropyl,  
10 3-Hydroxy-2-oxopropyl oder 3-Hydroxy-2-oxobutyl.

---

  - $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyl}$ , sowie die Alkenylteile von  
 $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenylcarbonyl}$ ,  $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyloxy}$ ,  
 $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyloxycarbonyl}$ ,  $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenylaminocarbonyl}$ ,  
15  $N\text{-(}C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyl)\text{-}N\text{-(}C_1\text{-}C_6\text{)alkylaminocarbonyl}$ ,  
 $N\text{-(}C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyl)\text{-}N\text{-(}C_1\text{-}C_6\text{-alkoxy)aminocarbonyl}$ : z.B.  
Prop-2-en-1-yl, But-1-en-4-yl, 1-Methyl-prop-2-en-1-yl,  
2-Methyl-prop-2-en-1-yl, 2-Buten-1-yl, 1-Penten-3-yl,  
1-Penten-4-yl, 2-Penten-4-yl, 1-Methyl-but-2-en-1-yl,  
20 2-Methyl-but-2-en-1-yl, 3-Methyl-but-2-en-1-yl,  
1-Methyl-but-3-en-1-yl, 2-Methyl-but-3-en-1-yl,  
3-Methyl-but-3-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-prop-2-en-1-yl,  
1,2-Dimethyl-prop-2-en-1-yl, 1-Ethyl-prop-2-en-1-yl,  
Hex-3-en-1-yl, Hex-4-en-1-yl, Hex-5-en-1-yl,  
25 1-Methyl-pent-3-en-1-yl, 2-Methyl-pent-3-en-1-yl,  
3-Methyl-pent-3-en-1-yl, 4-Methyl-pent-3-en-1-yl,  
1-Methyl-pent-4-en-1-yl, 2-Methyl-pent-4-en-1-yl,  
3-Methyl-pent-4-en-1-yl, 4-Methyl-pent-4-en-1-yl,  
1,1-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,1-Dimethyl-but-3-en-1-yl,  
30 1,2-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl,  
1,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl, 1,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl,  
2,2-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 2,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,  
2,3-Dimethyl-but-3-en-1-yl, 3,3-Dimethyl-but-2-en-1-yl,  
1-Ethyl-but-2-en-1-yl, 1-Ethyl-but-3-en-1-yl,  
35 2-Ethyl-but-2-en-1-yl, 2-Ethyl-but-3-en-1-yl,  
1,1,2-Trimethyl-prop-2-en-1-yl,  
1-Ethyl-1-methyl-prop-2-en-1-yl oder  
1-Ethyl-2-methyl-prop-2-en-1-yl;
  - 40 -  $C_2\text{-}C_6\text{-Alkenyl}$ , sowie die Alkenylteile von  
 $C_2\text{-}C_6\text{-Alkenylcarbonyl}$ , Phenyl- $C_2\text{-}C_6\text{-alkenylcarbonyl}$  und  
Heterocycl- $C_2\text{-}C_6\text{-alkenylcarbonyl}$ :  $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenyl}$ , wie  
voranstehend genannt, sowie Ethenyl;
  - 45 -  $C_3\text{-}C_6\text{-Halogenalkenyl}$ : einen  $C_3\text{-}C_6\text{-Alkenylrest}$ , wie vorstehend  
genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,  
Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B. 2-Chlorallyl,

## 25

3-Chlorallyl, 2,3-Dichlorallyl, 3,3-Dichlorallyl,  
 2,3,3-Tri-chlorallyl, 2,3-Dichlorbut-2-enyl, 2-Bromallyl,  
 3-Bromallyl, 2,3-Dibromallyl, 3,3-Dibromallyl,  
 2,3,3-Tribromallyl oder 2,3-Dibrombut-2-enyl;

5

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, sowie die Alkinylteile von  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylloxy,  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylloxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylaminocarbonyl,  
 N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,  
 N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxyaminocarbonyl: z.B.

10

Propargyl, But-1-in-3-yl, But-1-in-4-yl, But-2-in-1-yl,  
 Pent-1-in-3-yl, Pent-1-in-4-yl, Pent-1-in-5-yl,  
 Pent-2-in-1-yl, Pent-2-in-4-yl, Pent-2-in-5-yl,  
 3-Methyl-but-1-in-3-yl, 3-Methyl-but-1-in-4-yl,  
 Hex-1-in-3-yl, Hex-1-in-4-yl, Hex-1-in-5-yl, Hex-1-in-6-yl,  
 Hex-2-in-1-yl, Hex-2-in-4-yl, Hex-2-in-5-yl, Hex-2-in-6-yl,  
 Hex-3-in-1-yl, Hex-3-in-2-yl, 3-Methyl-pent-1-in-3-yl,  
 3-Methyl-pent-1-in-4-yl, 3-Methyl-pent-1-in-5-yl,  
 4-Methyl-pent-2-in-4-yl oder 4-Methyl-pent-2-in-5-yl;

15

- C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, sowie die Alkinylteile von  
 C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylcarbonyl: C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, wie voranstehend  
 genannt, sowie Ethinyl;

20

- C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl: einen C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylrest, wie vorstehend  
 genannt, der partiell oder vollständig durch Fluor, Chlor,  
 Brom und/oder Iod substituiert ist, also z.B.  
 1,1-Difluor-prop-2-in-1-yl, 3-Iod-prop-2-in-1-yl,  
 4-Fluorbut-2-in-1-yl, 4-Chlorbut-2-in-1-yl,  
 1,1-Difluorbut-2-in-1-yl, 4-Iod-but-3-in-1-yl,  
 5-Fluorpent-3-in-1-yl, 5-Iod-pent-4-in-1-yl,  
 6-Fluor-hex-4-in-1-yl oder 6-Iod-hex-5-in-1-yl;

25

- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkandiyl: Methandiyl, Ethan-1,1-diyl, Ethan-1,2-diyl,  
 Propan-1,1-diyl, Propan-1,2-diyl, Propan-1,3-diyl,  
 Propan-2,2-diyl, Butan-1,1-diyl, Butan-1,2-diyl,  
 Butan-1,3-diyl, Butan-1,4-diyl, 2-Methyl-propan-1,3-diyl,  
 2-Methyl-propan-1,2-diyl, 2-Methyl-propan-1,1-diyl,  
 1-Methyl-propan-1,2-diyl, 1-Methyl-propan-2,2-diyl,  
 1-Methyl-propan-1,1-diyl, Pentan-1,1-diyl, Pentan-1,2-diyl,  
 Pentan-1,3-diyl, Pentan-1,5-diyl, Pentan-2,3-diyl,  
 Pentan-2,2-diyl, 1-Methyl-butan-1,1-diyl,  
 1-Methyl-butan-1,2-diyl, 1-Methyl-butan-1,3-diyl,  
 1-Methyl-butan-1,4-diyl, 2-Methyl-butan-1,1-diyl,  
 2-Methyl-butan-1,2-diyl, 2-Methyl-butan-1,3-diyl,  
 2-Methyl-butan-1,4-diyl, 2,2-Dimethyl-propan-1,1-diyl,  
 2,2-Dimethyl-propan-1,3-diyl, 1,1-Dimethyl-propan-1,3-diyl,

## 26

1,1-Dimethyl-propan-1,2-diyl, 2,3-Dimethyl-propan-1,3-diyl,  
 2,3-Dimethyl-propan-1,2-diyl, 1,3-Dimethyl-propan-1,3-diyl,  
 Hexan-1,1-diyl, Hexan-1,2-diyl, Hexan-1,3-diyl,  
 Hexan-1,4-diyl-, Hexan-1,5-diyl, Hexan-1,6-diyl,  
 5      Hexan-2,5-diyl, 2-Methyl-pentan-1,1-diyl,  
 1-Methyl-pentan-1,2-diyl, 1-Methyl-pentan-1,3-diyl,  
 1-Methyl-pentan-1,4-diyl, 1-Methyl-pentan-1,5-diyl,  
 2-Methyl-pentan-1,1-diyl, 2-Methyl-pentan-1,2-diyl,  
 -2-Methyl-pentan-1,3-diyl, 2-Methyl-pentan-1,4-diyl,  
 10     2-Methyl-pentan-1,5-diyl, 3-Methyl-pentan-1,1-diyl,  
 3-Methyl-pentan-1,2-diyl, 3-Methyl-pentan-1,3-diyl,  
 3-Methyl-pentan-1,4-diyl, 3-Methyl-pentan-1,5-diyl,  
 1,1-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,1-Dimethyl-butan-1,3-diyl,  
 1,1-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1,2-Dimethyl-butan-1,1-diyl,  
 15    1,2-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,2-Dimethyl-butan-1,3-diyl,  
 1,2-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1,3-Dimethyl-butan-1,1-diyl,  
 1,3-Dimethyl-butan-1,2-diyl, 1,3-Dimethyl-butan-1,3-diyl,  
 1,3-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1-Ethyl-butan-1,1-diyl,  
 1-Ethyl-butan-1,2-diyl, 1-Ethyl-butan-1,3-diyl,  
 20    1-Ethyl-butan-1,4-diyl, 2-Ethyl-butan-1,1-diyl,  
 2-Ethyl-butan-1,2-diyl, 2-Ethyl-butan-1,3-diyl,  
 2-Ethyl-butan-1,4-diyl, 2-Ethyl-butan-2,3-diyl,  
 2,2-Dimethyl-butan-1,1-diyl, 2,2-Dimethyl-butan-1,3-diyl,  
 2,2-Dimethyl-butan-1,4-diyl, 1-Isopropyl-propan-1,1-diyl,  
 25    1-Isopropyl-propan-1,2-diyl, 1-Isopropyl-propan-1,3-diyl,  
 2-Isopropyl-propan-1,1-diyl, 2-Isopropyl-propan-1,2-diyl,  
 2-Isopropyl-propan-1,3-diyl, 1,2,3-Trimethyl-propan-1,1-diyl,  
 1,2,3-Trimethyl-propan-1,2-diyl oder  
 1,2,3-Trimethyl-propan-1,3-diyl;  
 30    - C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkendiyl: Ethen-1,1-diyl, Ethen-1,2-diyl,  
 1-Propen-1,1-diyl, 1-Propen-1,2-diyl, 1-Propen-1,3-diyl,  
 2-Propen-1,1-diyl, 2-Propen-1,2-diyl, 2-Propen-1,3-diyl,  
 1-Buten-1,1-diyl, 1-Buten-1,2-diyl, 1-Buten-1,3-diyl,  
 35    1-Buten-1,4-diyl, 2-Buten-1,1-diyl, 2-Buten-1,2-diyl,  
 2-Buten-1,3-diyl, 2-Buten-1,4-diyl, 3-Buten-1,1-diyl,  
 3-Buten-1,2-diyl, 3-Buten-1,3-diyl, 3-Buten-1,4-diyl,  
 1-Methyl-1-propen-1,2-diyl, 1-Methyl-1-propen-1,3-diyl,  
 1-Methyl-2-propen-1,1-diyl, 1-Methyl-2-propen-1,2-diyl,  
 40    1-Methyl-2-propen-1,3-diyl, 2-Methyl-1,1-propen-1,1-diyl,  
 2-Methyl-1-propen-1,3-diyl, 3-Buten-1,1-diyl,  
 3-Buten-1,2-diyl, 3-Buten-1,3-diyl, 3-Buten-1,4-diyl,  
 1-Penten-1,1-diyl, 1-Penten-1,2-diyl, 1-Penten-1,3-diyl,  
 1-Penten-1,4-diyl, 1-Penten-1,5-diyl, 1-Hexen-1,1-diyl,  
 45    1-Hexen-1,2-diyl, 1-Hexen-1,3-diyl, 1-Hexen-1,4-diyl,  
 1-Hexen-1,5-diyl oder 1-Hexen-1,6-diyl;

## 27

- $C_2-C_6$ -Alkadienyl: 1,3-Butadien-1,1-diyl,  
1,3-Butadien-1,2-diyl, 1,3-Butadien-1,3-diyl,  
1,3-Butadien-1,4-diyl, 1,3-Pentadien-1,1-diyl,  
1,3-Pentadien-1,2-diyl, 1,3-Pentadien-1,3-diyl,
- 5 1,3-Pentadien-1,4-diyl, 1,3-Pentadien-1,5-diyl,  
2,4-Pentadien-1,1-diyl, 2,4-Pentadien-1,2-diyl,  
2,4-Pentadien-1,3-diyl, 2,4-Pentadien-1,4-diyl,  
2,4-Pentadien-1,5-diyl, 1-Methyl-1,3-butadien-1,4-diyl,  
1,3-Hexadien-1,1-diyl, 1,3-Hexadien-1,2-diyl,
- 10 1,3-Hexadien-1,3-diyl, 1,3-Hexadien-1,4-diyl,  
1,3-Hexadien-1,5-diyl, 1,3-Hexadien-1,6-diyl,  
1-Methyl-1,3-pentadien-1,2-diyl,  
1-Methyl-1,3-pentadien-1,3-diyl,  
1-Methyl-1,3-pentadien-1,4-diyl oder
- 15 1-Methyl-1,3-pentadien-1,5-diyl;
  
- $C_2-C_6$ -Alkindiyl: Ethin-1,2-diyl, 1-Propin-1,3-diyl,  
2-Propin-1,1-diyl, 2-Propin-1,3-diyl, 1-Butin-1,3-diyl,  
1-Butin-1,4-diyl, 2-Butin-1,1-diyl, 2-Butin-1,4-diyl,
- 20 1-Methyl-2-propin-1,1-diyl, 1-Methyl-2-propin-1,3-diyl,  
1-Pentin-1,3-diyl, 1-Pentin-1,4-diyl, 1-Pentin-1,5-diyl,  
2-Pentin-1,1-diyl, 2-Pentin-1,4-diyl, 2-Pentin-1,5-diyl,  
3-Pentin-1,1-diyl, 3-Pentin-1,2-diyl, 3-Pentin-1,5-diyl,  
4-Pentin-1,1-diyl, 4-Pentin-1,2-diyl, 4-Pentin-1,3-diyl,
- 25 4-Pentin-1,5-diyl, 1-Hexin-1,3-diyl, 1-Hexin-1,4-diyl,  
1-Hexin-1,5-diyl, 1-Hexin-1,6-diyl, 2-Hexin-1,1-diyl,  
2-Hexin-1,4-diyl, 2-Hexin-1,5-diyl, 2-Hexin-1,6-diyl,  
3-Hexin-1,1-diyl, 3-Hexin-1,2-diyl, 3-Hexin-1,5-diyl,  
3-Hexin-1,6-diyl, 4-Hexin-1,1-diyl, 4-Hexin-1,2-diyl,
- 30 4-Hexin-1,3-diyl, 4-Hexin-1,6-diyl, 5-Hexin-1,1-diyl,  
5-Hexin-1,2-diyl, 5-Hexin-1,3-diyl, 5-Hexin-1,4-diyl oder  
5-Hexin-1,6-diyl;
  
- $C_3-C_6$ -Cycloalkyl, sowie die Cycloalkylteile von
- 35  $C_3-C_6$ -Cycloalkylamino und  $C_3-C_6$ -Cycloalkylcarbonyl: z.B.  
Cyclopropyl, Cyclobutyl, Cyclopentyl oder Cyclohexyl;
  
- Heterocyclyl, sowie Heterocyclylteile von Heterocyclyoxy,  
Heterocyclcarbonyl, Heterocyclyl- $C_1-C_4$ -alkyl,
- 40 Heterocyclyl- $C_1-C_6$ -alkyl, Heterocyclsulfonyl oder  
Heterocycloxysulfonyl, Heterocycloxycarbonyl,  
Heterocycloxythiocarbonyl,  
Heterocyclyl- $C_2-C_6$ -alkenylcarbonyl,  
Heterocyclcarbonyl- $C_1-C_6$ -alkyl,
- 45 N-( $C_1-C_6$ -Alkyl)-N-(heterocyclyl)-aminocarbonyl,  
Heterocyclaminocarbonyl: ein gesättigter, partiell  
gesättigter oder ungesättigter 5- oder 6-gliedriger,

## 28

heterocyclischer Ring, der ein, zwei, drei oder vier gleiche oder verschiedene Heteroatome, ausgewählt aus folgender Gruppe: Sauerstoff, Schwefel oder Stickstoff, enthält, also z.B. C-gebundene 5-gliedrige Ringe wie:

- 5            Tetrahydrofuran-2-yl, Tetrahydrofuran-3-yl,  
               Tetrahydrothien-2-yl, Tetrahydrothien-3-yl,  
               Tetrahydropyrrol-2-yl, Tetrahydropyrrol-3-yl,  
               2,3-Dihydrofuran-2-yl, 2,3-Dihydrofuran-3-yl,  
 10          2,5-Dihydrofuran-2-yl, 2,5-Dihydrofuran-3-yl,  
               4,5-Dihydrofuran-2-yl, 4,5-Dihydrofuran-3-yl,  
               2,3-Dihydrothien-2-yl, 2,3-Dihydrothien-3-yl,  
               2,5-Dihydrothien-2-yl, 2,5-Dihydrothien-3-yl,  
               4,5-Dihydrothien-2-yl, 4,5-Dihydrothien-3-yl,  
 15          2,3-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 2,3-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,  
               2,5-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,  
               4,5-Dihydro-1H-pyrrol-2-yl, 4,5-Dihydro-1H-pyrrol-3-yl,  
               3,4-Dihydro-2H-pyrrol-2-yl, 3,4-Dihydro-2H-pyrrol-3-yl,  
               3,4-Dihydro-5H-pyrrol-2-yl, 3,4-Dihydro-5H-pyrrol-3-yl,  
 20          2-Furyl, 3-Furyl, 2-Thienyl, 3-Thienyl, Pyrrol-2-yl,  
               Pyrrol-3-yl, Tetrahydropyrazol-3-yl, Tetrahydropyrazol-4-yl,  
               Tetrahydroisoxazol-3-yl, Tetrahydroisoxazol-4-yl,  
               Tetrahydroisoxazol-5-yl, 1,2-Oxathiolan-3-yl,  
               1,2-Oxathiolan-4-yl, 1,2-Oxathiolan-5-yl,  
 25          Tetrahydroisothiazol-3-yl, Tetrahydro-isothiazol-4-yl,  
               Tetrahydroisothiazol-5-yl, 1,2-Dithiolan-3-yl,  
               1,2-Dithiolan-4-yl, Tetrahydroimidazol-2-yl,  
               Tetrahydroimidazol-4-yl, Tetrahydrooxazol-2-yl,  
               Tetrahydrooxazol-4-yl, Tetrahydrooxazol-5-yl,  
 30          Tetrahydrothiazol-2-yl, Tetrahydrothiazol-4-yl,  
               Tetrahydrothiazol-5-yl, 1,3-Dioxolan-2-yl,  
               1,3-Dioxolan-4-yl, 1,3-Oxathiolan-2-yl, 1,3-Oxathiolan-4-yl,  
               1,3-Oxathiolan-5-yl, 1,3-Dithiolan-2-yl, 1,3-Dithiolan-4-yl,  
 35          4,5-Dihydro-1H-pyrazol-3-yl, 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-4-yl,  
               4,5-Dihydro-1H-pyrazol-5-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-3-yl,  
               2,5-Dihydro-1H-pyrazol-4-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-5-yl,  
               4,5-Dihydroisoxazol-3-yl, 4,5-Dihydroisoxazol-4-yl,  
               4,5-Dihydroisoxazol-5-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-3-yl,  
               2,5-Dihydroisoxazol-4-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-5-yl,  
 40          2,3-Dihydroisoxazol-3-yl, 2,3-Dihydroisoxazol-4-yl,  
               2,3-Dihydroisoxazol-5-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-3-yl,  
               4,5-Dihydroisothiazol-4-yl, 4,5-Dihydroisothiazol-5-yl,  
               2,5-Dihydroisothiazol-3-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-4-yl,  
               2,5-Dihydroisothiazol-5-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-3-yl,  
 45          2,3-Dihydroisothiazol-4-yl, 2,3-Dihydroisothiazol-5-yl,  
               Δ<sup>3</sup>-1,2-Dithiol-3-yl, Δ<sup>3</sup>-1,2-Dithiol-4-yl,  
               Δ<sup>3</sup>-1,2-Dithiol-5-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl,

## 29

4,5-Dihydro-1H-imidazol-4-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-5-yl,  
 2,5-Dihydro-1H-imidazol-2-yl, 2,5-Dihydro-1H-imidazol-4-yl,  
 2,5-Dihydro-1H-imidazol-5-yl, 2,3-Dihydro-1H-imidazol-2-yl,  
 2,3-Dihydro-1H-imidazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-2-yl,  
 5 4,5-Dihydrooxazol-4-yl, 4,5-Dihydrooxazol-5-yl,  
 2,5-Dihydrooxazol-2-yl, 2,5-Dihydrooxazol-4-yl,  
 2,5-Dihydrooxazol-5-yl, 2,3-Dihydrooxazol-2-yl,  
 2,3-Dihydrooxazol-4-yl, 2,3-Dihydrooxazol-5-yl,  
 4,5-Dihydrothiazol-2-yl, 4,5-Dihydrothiazol-4-yl,  
 10 4,5-Dihydrothiazol-5-yl, 2,5-Dihydrothiazol-2-yl,  
 2,5-Dihydrothiazol-4-yl, 2,5-Dihydrothiazol-5-yl,  
 2,3-Dihydrothiazol-2-yl, 2,3-Dihydrothiazol-4-yl,  
 2,3-Dihydrothiazol-5-yl, 1,3-Dioxol-2-yl, 1,3-Dioxol-4-yl,  
 1,3-Dithiol-2-yl, 1,3-Dithiol-4-yl, 1,3-Oxathiol-2-yl,  
 15 1,3-Oxathiol-4-yl, 1,3-Oxathiol-5-yl, Pyrazol-3-yl,  
 Pyrazol-4-yl, Isoxazol-3-yl, Isoxazol-4-yl, Isoxazol-5-yl,  
 Isothiazol-3-yl, Isothiazol-4-yl, Isothiazol-5-yl,  
 Imidazol-2-yl, Imidazol-4-yl, Oxazol-2-yl, Oxazol-4-yl,  
 Oxazol-5-yl, Thiazol-2-yl, Thiazol-4-yl, Thiazol-5-yl,  
 20 1,2,3- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,3- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-5-yl,  
 1,2,4- $\Delta^4$ -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^4$ -Oxadiazolin-5-yl,  
 1,2,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-5-yl,  
 1,2,4- $\Delta^3$ -Oxadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^3$ -Oxadiazolin-5-yl,  
 1,3,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-2-yl, 1,3,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-5-yl,  
 25 1,3,4- $\Delta^3$ -Oxadiazolin-2-yl, 1,3,4-Oxadiazolin-2-yl,  
 1,2,4- $\Delta^4$ -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^4$ -Thiadiazolin-5-yl,  
 1,2,4- $\Delta^3$ -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^3$ -Thiadiazolin-5-yl,  
 1,2,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-3-yl, 1,2,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-5-yl,  
 1,3,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-2-yl, 1,3,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-5-yl,  
 30 1,3,4- $\Delta^3$ -Thiadiazolin-2-yl, 1,3,4-Thiadiazolin-2-yl,  
 1,3,2-Dioxathiolan-4-yl, 1,2,3- $\Delta^2$ -Triazolin-4-yl,  
 1,2,3- $\Delta^2$ -Triazolin-5-yl, 1,2,4- $\Delta^2$ -Triazolin-3-yl,  
 1,2,4- $\Delta^2$ -Triazolin-5-yl, 1,2,4- $\Delta^3$ -Triazolin-3-yl,  
 1,2,4- $\Delta^3$ -Triazolin-5-yl, 1,2,4- $\Delta^1$ -Triazolin-2-yl,  
 35 1,2,4-Triazolin-3-yl, 3H-1,2,4-Dithiazol-5-yl,  
 2H-1,3,4-Dithiazol-5-yl, 2H-1,3,4-Oxathiazol-5-yl,  
 1,2,3-Oxadiazol-4-yl, 1,2,3-Oxadiazol-5-yl,  
 1,2,4-Oxadiazol-3-yl, 1,2,4-Oxadiazol-5-yl,  
 1,3,4-Oxadiazol-2-yl, 1,2,3-Thiadiazol-4-yl,  
 40 1,2,3-Thiadiazol-5-yl, 1,2,4-Thiadiazol-3-yl,  
 1,2,4-Thiadiazol-5-yl, 1,3,4-Thiadiazolyl-2-yl,  
 1,2,3-Triazol-4-yl, 1,2,4-Triazol-3-yl, Tetrazol-5-yl;

C-gebundene 6-gliedrige Ringe wie:

## 30

Tetrahydropyran-2-yl, Tetrahydropyran-3-yl,  
 Tetrahydropyran-4-yl, Piperidin-2-yl, Piperidin-3-yl,  
 Piperidin-4-yl, Tetrahydrothiopyran-2-yl,  
 Tetrahydrothiopyran-3-yl, Tetrahydrothiopyran-4-yl,  
 5 2H-3,4-Dihydropyran-6-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-5-yl,  
 2H-3,4-Dihydropyran-4-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-3-yl,  
 2H-3,4-Dihydropyran-2-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-6-yl,  
 2H-3,4-Dihydrothiopyran-5-yl, 2H-3,4-Dihydrothiopyran-4-yl,  
 - 2H-3,4-Dihydropyran-3-yl, 2H-3,4-Dihydropyran-2-yl,  
 10 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-6-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-5-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-4-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-3-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-2-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-2-yl,  
 15 2H-5,6-Dihydropyran-3-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-4-yl,  
 2H-5,6-Dihydropyran-5-yl, 2H-5,6-Dihydropyran-6-yl,  
 2H-5,6-Dihydrothiopyran-2-yl, 2H-5,6-Dihydrothiopyran-3-yl,  
 2H-5,6-Dihydrothiopyran-4-yl, 2H-5,6-Dihydrothiopyran-5-yl,  
 2H-5,6-Dihydrothiopyran-6-yl, 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-2-yl,  
 20 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-3-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-4-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-5-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-6-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-2-yl,  
 25 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-3-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-4-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-5-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridin-6-yl, 4H-Pyran-2-yl, 4H-Pyran-3-yl,  
 4H-Pyran-4-yl, 4H-Thiopyran-2-yl, 4H-Thiopyran-3-yl,  
 30 4H-Thiopyran-4-yl, 1,4-Dihydropyridin-2-yl,  
 1,4-Dihydropyridin-3-yl, 1,4-Dihydropyridin-4-yl,  
 2H-Pyran-2-yl, 2H-Pyran-3-yl, 2H-Pyran-4-yl, 2H-Pyran-5-yl,  
 2H-Pyran-6-yl, 2H-Thiopyran-2-yl, 2H-Thiopyran-3-yl,  
 2H-Thiopyran-4-yl, 2H-Thiopyran-5-yl, 2H-Thiopyran-6-yl,  
 35 1,2-Dihydropyridin-2-yl, 1,2-Dihydropyridin-3-yl,  
 1,2-Dihydropyridin-4-yl, 1,2-Dihydropyridin-5-yl,  
 1,2-Dihydropyridin-6-yl, 3,4-Dihydropyridin-2-yl,  
 3,4-Dihydropyridin-3-yl, 3,4-Dihydropyridin-4-yl,  
 3,4-Dihydropyridin-5-yl, 3,4-Dihydropyridin-6-yl,  
 40 2,5-Dihydropyridin-2-yl, 2,5-Dihydropyridin-3-yl,  
 2,5-Dihydropyridin-4-yl, 2,5-Dihydropyridin-5-yl,  
 2,5-Dihydropyridin-6-yl, 2,3-Dihydropyridin-2-yl,  
 2,3-Dihydropyridin-3-yl, 2,3-Dihydropyridin-4-yl,  
 2,3-Dihydropyridin-5-yl, 2,3-Dihydropyridin-6-yl,  
 45 Pyridin-2-yl, Pyridin-3-yl, Pyridin-4-yl, 1,3-Dioxan-2-yl,  
 1,3-Dioxan-4-yl, 1,3-Dioxan-5-yl, 1,4-Dioxan-2-yl,  
 1,3-Dithian-2-yl, 1,3-Dithian-4-yl, 1,3-Dithian-5-yl,

## 31

1,4-Dithian-2-yl, 1,3-Oxathian-2-yl, 1,3-Oxathian-4-yl,  
1,3-Oxathian-5-yl, 1,3-Oxathian-6-yl, 1,4-Oxathian-2-yl,  
1,4-Oxathian-3-yl, 1,2-Dithian-3-yl, 1,2-Dithian-4-yl,  
Hexahydropyrimidin-2-yl, Hexahydropyrimidin-4-yl,  
5 Hexahydropyrimidin-5-yl, Hexahydropyrazin-2-yl,  
Hexahydropyridazin-3-yl, Hexahydropyridazin-4-yl,  
Tetrahydro-1,3-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-4-yl,  
Tetrahydro-1,3-oxazin-5-yl, Tetrahydro-1,3-oxazin-6-yl,  
Tetrahydro-1,3-thiazin-2-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-4-yl,  
10 Tetrahydro-1,3-thiazin-5-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-6-yl,  
Tetrahydro-1,4-thiazin-2-yl, Tetrahydro-1,4-thiazin-3-yl,  
Tetrahydro-1,4-oxazin-2-yl, Tetrahydro-1,4-oxazin-3-yl,  
Tetrahydro-1,2-oxazin-3-yl, Tetrahydro-1,2-oxazin-4-yl,  
Tetrahydro-1,2-oxazin-5-yl, Tetrahydro-1,2-oxazin-6-yl,  
15 2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,  
20 2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,  
2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,  
25 4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,  
4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,  
30 4H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,  
35 2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,  
2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-3-yl,  
40 2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-4-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-5-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-oxazin-6-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-3-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-4-yl,  
45 2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-5-yl,  
2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-6-yl,  
2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-3-yl,

## 32

2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-4-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-5-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-6-yl,  
 3,4,5,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,  
 5 3,4,5,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-5-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-6-yl,  
 10 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-3-yl,  
 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-4-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-2-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-4-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-5-yl,  
 15 4H-5,6-Dihydro-1,3-oxazin-6-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-2-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-4-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-5-yl,  
 4H-5,6-Dihydro-1,3-thiazin-6-yl,  
 20 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-2-yl,  
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-4-yl,  
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-5-yl,  
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-6-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-2-yl,  
 25 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-5-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-2-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-4-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-5-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-6-yl,  
 30 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-2-yl, 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-3-yl,  
 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-5-yl, 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-6-yl,  
 2H-1,2-Oxazin-3-yl, 2H-1,2-Oxazin-4-yl, 2H-1,2-Oxazin-5-yl,  
 2H-1,2-Oxazin-6-yl, 2H-1,2-Thiazin-3-yl, 2H-1,2-Thiazin-4-yl,  
 2H-1,2-Thiazin-5-yl, 2H-1,2-Thiazin-6-yl, 4H-1,2-Oxazin-3-yl,  
 35 4H-1,2-Oxazin-4-yl, 4H-1,2-Oxazin-5-yl, 4H-1,2-Oxazin-6-yl,  
 4H-1,2-Thiazin-3-yl, 4H-1,2-Thiazin-4-yl,  
 4H-1,2-Thiazin-5-yl, 4H-1,2-Thiazin-6-yl, 6H-1,2-Oxazin-3-yl,  
 6H-1,2-Oxazin-4-yl, 6H-1,2-Oxazin-5-yl, 6H-1,2-Oxazin-6-yl,  
 6H-1,2-Thiazin-3-yl, 6H-1,2-Thiazin-4-yl,  
 40 6H-1,2-Thiazin-5-yl, 6H-1,2-Thiazin-6-yl, 2H-1,3-Oxazin-2-yl,  
 2H-1,3-Oxazin-4-yl, 2H-1,3-Oxazin-5-yl, 2H-1,3-Oxazin-6-yl,  
 2H-1,3-Thiazin-2-yl, 2H-1,3-Thiazin-4-yl,  
 2H-1,3-Thiazin-5-yl, 2H-1,3-Thiazin-6-yl, 4H-1,3-Oxazin-2-yl,  
 4H-1,3-Oxazin-4-yl, 4H-1,3-Oxazin-5-yl, 4H-1,3-Oxazin-6-yl,  
 45 4H-1,3-Thiazin-2-yl, 4H-1,3-Thiazin-4-yl,  
 4H-1,3-Thiazin-5-yl, 4H-1,3-Thiazin-6-yl, 6H-1,3-Oxazin-2-yl,  
 6H-1,3-Oxazin-4-yl, 6H-1,3-Oxazin-5-yl, 6H-1,3-Oxazin-6-yl,

## 33

6H-1,3-Thiazin-2-yl, 6H-1,3-Oxazin-4-yl, 6H-1,3-Oxazin-5-yl,  
 6H-1,3-Thiazin-6-yl, 2H-1,4-Oxazin-2-yl, 2H-1,4-Oxazin-3-yl,  
 2H-1,4-Oxazin-5-yl, 2H-1,4-Oxazin-6-yl, 2H-1,4-Thiazin-2-yl,  
 2H-1,4-Thiazin-3-yl, 2H-1,4-Thiazin-5-yl,  
 5 2H-1,4-Thiazin-6-yl, 4H-1,4-Oxazin-2-yl, 4H-1,4-Oxazin-3-yl,  
 4H-1,4-Thiazin-2-yl, 4H-1,4-Thiazin-3-yl,  
 1,4-Dihydropyridazin-3-yl, 1,4-Dihydropyridazin-4-yl,  
 1,4-Dihydropyridazin-5-yl, 1,4-Dihydropyridazin-6-yl,  
 1,4-Dihydropyrazin-2-yl, 1,2-Dihydropyrazin-2-yl,  
 10 1,2-Dihydropyrazin-3-yl, 1,2-Dihydropyrazin-5-yl,  
 1,2-Dihydropyrazin-6-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-2-yl,  
 1,4-Dihydropyrimidin-4-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-5-yl,  
 1,4-Dihydropyrimidin-6-yl, 3,4-Dihydropyrimidin-2-yl,  
 3,4-Dihydropyrimidin-4-yl, 3,4-Dihydropyrimidin-5-yl,  
 15 3,4-Dihydropyrimidin-6-yl, Pyridazin-3-yl, Pyridazin-4-yl,  
 Pyrimidin-2-yl, Pyrimidin-4-yl, Pyrimidin-5-yl, Pyrazin-2-yl,  
 1,3,5-Triazin-2-yl, 1,2,4-Triazin-3-yl, 1,2,4-Triazin-5-yl,  
 1,2,4-Triazin-6-yl oder 1,2,4,5-Tetra-zin-3-yl;

## 20 N-gebundene 5-gliedrige Ringe wie:

Tetrahydropyrrol-1-yl, 2,3-Dihydro-1H-pyrrol-1-yl,  
 2,5-Dihydro-1H-pyrrol-1-yl, Pyrrol-1-yl,  
 Tetrahydropyrazol-1-yl, Tetrahydroisoxazol-2-yl,  
 25 Tetrahydroisothiazol-2-yl, Tetrahydroimidazol-1-yl,  
 Tetrahydrooxazol-3-yl, Tetrahydrothiazol-3-yl,  
 4,5-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl, 2,5-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl,  
 2,3-Dihydro-1H-pyrazol-1-yl, 2,5-Dihydroisoxazol-2-yl,  
 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, 2,5-Dihydroisothiazol-2-yl,  
 30 2,3-Dihydroisoxazol-2-yl, 4,5-Dihydro-1H-imidazol-1-yl,  
 2,5-Dihydro-1H-imidazol-1-yl, 2,3-Dihydro-1H-imidazol-1-yl,  
 2,3-Dihydrooxazol-3-yl, 2,3-Dihydrothiazol-3-yl,  
 Pyrazol-1-yl, Imidazol-1-yl, 1,2,4- $\Delta^4$ -Oxadiazolin-2-yl,  
 1,2,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,4- $\Delta^3$ -Oxadiazolin-2-yl,  
 35 1,3,4- $\Delta^2$ -Oxadiazolin-4-yl, 1,2,4- $\Delta^5$ -Thiadiazolin-2-yl,  
 1,2,4- $\Delta^3$ -Thiadiazolin-2-yl, 1,2,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-4-yl,  
 1,3,4- $\Delta^2$ -Thiadiazolin-4-yl, 1,2,3- $\Delta^2$ -Triazolin-1-yl,  
 1,2,4- $\Delta^2$ -Triazolin-1-yl, 1,2,4- $\Delta^2$ -Triazolin-4-yl,  
 40 1,2,4- $\Delta^3$ -Triazolin-1-yl, 1,2,4- $\Delta^1$ -Triazolin-4-yl,  
 1,2,3-Triazol-1-yl, 1,2,4-Triazol-1-yl, Tetrazol-1-yl;

## N-gebundene 6-gliedrige Ringe wie:

Piperidin-1-yl, 1,2,3,4-Tetrahydropyridin-1-yl,  
 45 1,2,5,6-Tetrahydropyridin-1-yl, 1,4-Dihydropyridin-1-yl,  
 1,2-Dihydropyridin-1-yl, Hexahydropyrimidin-1-yl,  
 Hexahydropyrazin-1-yl, Hexahydropyridazin-1-yl,

## 34

- Tetrahydro-1,3-oxazin-3-yl, Tetrahydro-1,3-thiazin-3-yl,  
 Tetrahydro-1,4-thiazin-4-yl, Tetrahydro-1,4-oxazin-4-yl  
 (Morpholinyl), Tetrahydro-1,2-oxazin-2-yl,  
 2H-5,6-Dihydro-1,2-oxazin-2-yl,  
 5 2H-5,6-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,  
 2H-3,6-Dihydro-1,2-oxazin-2-yl,  
 2H-3,6-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,  
 2H-3,4-Dihydro-1,2-thiazin-2-yl,  
 2,3,4,5-Tetrahydropyridazin-2-yl,  
 10 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-1-yl,  
 1,2,5,6-Tetrahydropyridazin-2-yl,  
 1,2,3,6-Tetrahydropyridazin-1-yl,  
 3,4,5,6-Tetrahydropyrimidin-3-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrazin-1-yl,  
 15 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-1-yl,  
 1,2,3,4-Tetrahydropyrimidin-3-yl,  
 2,3-Dihydro-1,4-thiazin-4-yl, 2H-1,2-Oxazin-2-yl,  
 2H-1,2-Thiazin-2-yl, 4H-1,4-Oxazin-4-yl, 4H-1,4-Thiazin-4-yl,  
 1,4-Dihydropyridazin-1-yl, 1,4-Dihydropyrazin-1-yl,  
 20 1,2-Dihydropyrazin-1-yl, 1,4-Dihydropyrimidin-1-yl oder  
 3,4-Dihydropyrimidin-3-yl;

sowie N-gebundene cyclische Imide wie:

- 25 Phthalsäureimid, Tetrahydraphthalsäureimid, Succinimid,  
 Maleimid, Glutarimid, 5-Oxo-triazolin-1-yl,  
 5-Oxo-1,3,4-oxadiazolin-4-yl oder  
 2,4-Dioxo-(1H,3H)-pyrimidin-3-yl;  
 30 wobei mit einem ankondensierten Phenylring oder mit einem  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Carbocyclus oder einem weiteren 5- bis 6-gliedrigen  
 Heterocyclus ein bicyclisches Ringsystem ausgebildet werden  
 kann,  
 35 wobei gegebenenfalls der Schwefel der genannten Heterocyclen  
 zu S=O oder S(=O)<sub>2</sub> oxidiert sein kann  
 und wobei mit einem ankondensierten Phenylring oder mit einem  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Carbocyclus oder mit einem weiteren 5- bis 6-gliedrigen  
 40 Heterocyclus ein bicyclisches Ringsystem ausgebildet werden  
 kann.

Alle Phenylringe bzw. Heterocyclreste sowie alle  
 Phenylkomponenten in Phenoxy, Phenylalkyl, Phenylcarbonylalkyl,  
 45 Phenylcarbonyl, Phenylalkenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl,  
 Phenoxythiocarbonyl, Phenylaminocarbonyl und  
 N-Alkyl-N-phenylaminocarbonyl, Phenylsulfonyl oder

- Phenoxyfonyl bzw. Heterocyclkomponenten in Heterocyclyoxy,  
 Heterocyclalkyl, Heterocyclcarbonylalkyl,  
 Heterocyclcarbonyl, Heterocyclyloxythiocarbonyl,  
 Heterocyclalkenylcarbonyl, Heterocyclyloxycarbonyl,  
 5 Heterocyclaminocarbonyl, N-Alkyl-N-heterocyclaminocarbonyl,  
 Heterocyclsulfonyl oder Heterocyclyoxysulfonyl sind, soweit  
 nicht anders angegeben, vorzugsweise unsubstituiert oder tragen  
 ein, zwei oder drei Halogenatome und/oder eine Nitrogruppe, einen  
 Cyanorest und/oder einen oder zwei Methyl-, Trifluormethyl-,  
 10 Methoxy- oder Trifluormethoxysubstituenten.  
 Im Hinblick auf die Verwendung der erfundungsgemäßen Verbindungen  
 der Formel I als Herbizide haben die Variablen X, Y, R<sup>1</sup> bis R<sup>16</sup>  
 vorzugsweise folgende Bedeutungen, und zwar jeweils für sich  
 alleine oder in Kombination:
- 15 R<sup>1</sup> Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyloxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 20 besonders bevorzugt Methyl, Chlor, Methoxy,  
 Methylthio, Methylsulfinyl, Methylsulfonyl,  
 Brommethyl, Methoxymethyl, Methylsulfonylmethyl;
- R<sup>2</sup> Wasserstoff, Halogen, z.B. Chlor oder Brom,  
 25 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, z.B. Methyl;
- X C-R<sup>3</sup> mit den für R<sup>3</sup> zuvor genannten Bedeutungen oder  
 N;
- 30 Y S, SO<sub>2</sub> oder NR<sup>4</sup> mit den für R<sup>4</sup> zuvor genannten Bedeu-  
 tungen;
- Pz Rest der allgemeinen Formel IIa, worin R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup>  
 die zuvor genannten Bedeutungen haben.
- 35 Bevorzugt sind insbesondere Verbindungen der Formel I, worin Y  
 für O, S, SO<sub>2</sub> oder N-R<sup>4</sup> und X für C-R<sup>3</sup> stehen. Bevorzugt sind auch  
 Verbindungen der Formel I, worin X für N und Y für S oder N-R<sup>4</sup>  
 40 stehen.
- Bevorzugt haben R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> unabhängig voneinander die folgen-  
 den Bedeutungen:
- 45 R<sup>8</sup> Hydroxy, Halogen, OR<sup>11</sup>, SR<sup>11</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>,  
 ONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup> oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell  
 oder vollständig halogeniert sein kann und/oder

## 36

einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy; insbesondere Hydroxy, OR<sup>11</sup> und OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, speziell Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyloxy, O-CH<sub>2</sub>-Phenyl, Phenylcarbonyloxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenylcarbonyloxy, Cyclopropylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Sulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy und 2-, 3- oder 4-Methylphenylsulfonyloxy;

5

10 R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, insbesondere C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, und

R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.

15 Bevorzugt sind auch Verbindungen, in denen R<sup>9</sup> für C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, insbesondere Cyclopropyl steht.

Besonders bevorzugt sind Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für C-R<sup>3</sup> steht und

20

R<sup>3</sup> für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

25

Phenyl oder Pyridyl, wobei die zwei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei, insbesondere einen der folgenden Reste: Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können;

oder

35

COOR<sup>5</sup> mit den für R<sup>5</sup> zuvor genannten Bedeutungen steht. Hierin steht R<sup>5</sup> insbesondere für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl und besonders bevorzugt für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl, iso-Propyl, n-Butyl, 2-Butyl, iso-Butyl und tert.-Butyl.

40

Bevorzugt sind auch Verbindungen I, in denen R<sup>3</sup> C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl oder Phenoxy, das wie für Phenyl angegeben substituiert sein kann, bedeutet.

45

Beispiele für bevorzugte Reste R<sup>3</sup> sind Wasserstoff, Fluor, Chlor, Brom, Cyano, Rhodano, Methyl, Ethyl, n-Propyl, Isopropyl, n-Butyl, 2-Butyl, Isobutyl, tert-Butyl, Chlormethyl, Dichlormethyl,

Trichlormethyl, Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl,  
 2,2,2-Trifluorethyl, Methoxymethyl, Ethoxymethyl, Methoxy,  
 Ethoxy, 1-Propoxy, 2-Propoxy, 1-Butoxy, 2-Butoxy, 2-Methyl-  
 prop-1-oxy, tert-Butyloxy, Difluormethyloxy, Trifluormethyloxy,  
 5 2,2,2-Trifluorethyl-1-oxy, (Methoxy)methyloxy, Methylsulfanyl,  
 Ethylsulfanyl, n-Propylsulfanyl, Isopropylsulfanyl, 1-Butylsulfa-  
 nyl, 2-Butylsulfanyl, 2-Methylprop-1-ylsulfanyl, tert-Butylsulfa-  
 nyl, Fluormethylsulfanyl, Trifluormethylsulfanyl, 2,2,2-Trifluo-  
 rethyl-1-sulfanyl, 2-(Methylcarbonyl)ethyl, Phenyl, 2-, 3- oder  
 10 4-Fluorphenyl, 2-, 3- oder 4-Chlorphenyl, 2-, 3- oder 4-Hydroxy-  
 phenyl, 2-, 3- oder 4-Methoxyphenyl, 2-, 3- oder 4-(Trifluorme-  
 thoxy)phenyl, 2-, 3- oder 4-(Difluormethoxy)phenyl, 2-, 3- oder  
 4-(Trifluormethyl)phenyl, 2-, 3- oder 4-Tolyl, 2-, 3- oder 4-Py-  
 ridinyl, 2-, 3- oder 4-Fluorphenoxy, 2-, 3- oder 4-Methoxyphe-  
 noxy, 2-, 3- oder 4-Trifluormethylphenoxy, 2-, 3- oder 4-Chlor-  
 phenoxy, Methoxycarbonyl, Ethoxycarbonyl, Trifluormethoxycarbo-  
 nyl, Isopropoxycarbonyl, tert-Butoxycarbonyl und Phenoxy carbonyl.

Ganz besonders bevorzugte Verbindungen der allgemeinen Formel I  
 20 mit X = C-R<sup>3</sup> sind solche Verbindungen, worin R<sup>3</sup> für Wasserstoff,  
 Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halo-  
 nalkyl, insbesondere Fluormethyl, Difluormethyl, Trifluormethyl  
 und 2,2,2-Trifluorethyl, oder für Phenyl oder Phenoxy steht, wo-  
 bei Phenyl oder Phenoxy einen, zwei oder drei und insbesondere  
 25 einen Substituenten, ausgewählt unter C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere  
 Methyl, Halogen, insbesondere Fluor oder Chlor, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, ins-  
 besondere Methoxy, oder Halogenalkoxy, insbesondere Trifluorme-  
 thoxy, tragen kann.

30 Unter den vorstehend genannten Pyrazolderivaten der allgemeinen  
 Formel I sind solche Verbindungen besonders bevorzugt, die sich  
 von der Benzothiazol-5-carbonsäure ableiten, also Verbindungen  
 der allgemeinen Formel I, worin X für einen Rest C-R<sup>3</sup> steht und Y  
 ausgewählt ist unter S, SO, und SO<sub>2</sub>. Unter den Pyrazol-Derivaten  
 35 des Benzothiazols sind wiederum solche bevorzugt, worin R<sup>3</sup> eine  
 der zuvor als bevorzugt genannten Bedeutungen aufweist. Insbeson-  
 dere steht Y für S oder SO<sub>2</sub>.

Erfnungsgemäß bevorzugt sind auch solche Pyrazolylderivate, die  
 40 sich von der Benzoaxazol-5-carbonsäure ableiten, d.h. Verbindun-  
 gen der allgemeinen Formel I, worin X für eine Gruppe C-R<sup>3</sup> mit den  
 zuvor für R<sup>3</sup> angegebenen Bedeutungen und Y für ein Sauerstoffatom  
 stehen. Hierunter sind wiederum solche Verbindungen bevorzugt,  
 worin R<sup>3</sup> die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweist.

Ebenfalls bevorzugt sind Pyrazolderivate der allgemeinen Formel I, die sich von der Benzimidazol-5-carbonsäure ableiten, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für C-R<sup>3</sup> mit den für R<sup>3</sup> zuvor genannten Bedeutungen und Y für eine Gruppe N-R<sup>4</sup> mit 5 den zuvor für R<sup>4</sup> genannten Bedeutungen stehen. Hierunter sind solche Benzimidazolderivate der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R<sup>3</sup> die zuvor als für R<sup>3</sup> bevorzugt genannten Bedeutungen aufweist. Ferner sind Benzimidazol-Derivate der allgemeinen Formel I bevorzugt, worin R<sup>4</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halo-10 genalkyl, insbesondere für Wasserstoff, Methyl, Ethyl, n-Propyl und iso-Propyl.

Erfindungsgemäß bevorzugt sind auch Pyrazolylderivate der Benzotriazol-5-carbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel 15 I, worin X für Stickstoff und Y für eine Gruppe N-R<sup>4</sup> mit den zuvor für R<sup>4</sup> angegebenen Bedeutungen steht. Hierunter sind wiederum solche Verbindungen bevorzugt, worin R<sup>4</sup> die zuvor als bevorzugt angegebenen Bedeutungen aufweist.

20 Erfindungsgemäß bevorzugt sind auch Pyrazolylderivate der Benzo-thiadiazol-5-carbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X für N und Y für S steht. Ebenfalls bevorzugt sind Pyrazolderivate der Benzoisothiadiazolcarbonsäure, also Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin X-Y für S=N steht und X 25 für S steht.

Unter den als bevorzugt angegebenen Pyrazolyl-Derivaten der allgemeinen Formel I sind wiederum solche Verbindungen bevorzugt, worin Pz in Formel I für eine Gruppe der allgemeinen Formel IIa 30 steht. Hierunter sind wiederum Verbindungen der allgemeinen Formel I besonders bevorzugt, worin die Variablen R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> in Formel IIa für sich alleine, und besonders bevorzugt in Kombination miteinander, die folgenden Bedeutungen aufweisen:

35 R<sup>8</sup> Hydroxy, Halogen, OR<sup>11</sup>, SR<sup>11</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, ONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup> oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, 40 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, insbesondere Hydroxy, OR<sup>11</sup> und OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>;

R<sup>9</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Cyclopropyl;

45 R<sup>10</sup> Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl.

## 39

Unter den Verbindungen der allgemeinen Formel I, worin Pz für einen Pyrazolylrest der allgemeinen Formel IIa steht, sind solche Verbindungen ganz besonders bevorzugt, worin die Variablen R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> gemeinsam die folgenden Bedeutungen aufweisen:

5

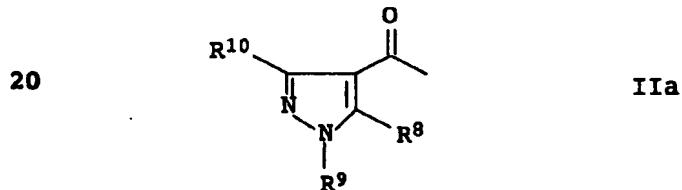
R<sup>8</sup> für Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyloxy, O-CH<sub>2</sub>-Phenyl, Phenylcarbonyloxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenylcarbonyloxy, Cyclopropylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Sulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy und 2-, 3- oder 4-Methylphenylsulfonyloxy;

10

R<sup>9</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Cyclopropyl und

R<sup>10</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl stehen.

15 Ganz besonders bevorzugte Reste der allgemeinen Formel IIa sind die in Tabelle 1 angegebenen Reste IIa1 bis IIa90.



25 Tabelle 1

IIa	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>
IIa1	OH	CH <sub>3</sub>	H
IIa2	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa3	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa4	OC(O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa5	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa6	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	CH <sub>3</sub>	H
IIa7	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa8	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	CH <sub>3</sub>	H
IIa9	OH	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa10	OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa11	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa12	OC(O)CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa13	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa14	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa15	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa16	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa17	OH	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
IIa18	OCH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H

	IIa	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>
5	IIa19	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
	IIa20	OC(O)CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
	IIa21	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
	IIa22	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
	IIa23	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
	IIa24	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
10	IIa25	OH	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa26	OCH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa27	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa28	OC(O)CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa29	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa30	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
15	IIa31	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa32	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
	IIa33	OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa34	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa35	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa36	OC(O)CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	IIa37	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa38	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa39	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa40	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa41	OH	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa42	OCH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
25	IIa43	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa44	OC(O)CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa45	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa46	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa47	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa48	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
30	IIa49	OH	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa50	OCH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa51	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa52	OC(O)CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa53	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa54	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
35	IIa55	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa56	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
	IIa57	OH	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>

## 41

IIa	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>
IIa58	OCH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa59	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
5 IIa60	OC(O)CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa61	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa62	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa63	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
10 IIa64	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa65	OH	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa66	OCH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa67	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
15 IIa68	OC(O)CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa69	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa70	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa71	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa72	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
20 IIa73	OH	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa74	OCH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa75	OCH <sub>2</sub> -C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa76	OC(O)CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
25 IIa77	OC(O)C <sub>6</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa78	OC(O)-(3-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> F)	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa79	OS(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa80	OS(O) <sub>2</sub> -(4-C <sub>6</sub> H <sub>4</sub> CH <sub>3</sub> )	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
30 IIa81	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
IIa82	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa83	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	H
IIa84	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	H
35 IIa85	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	H
IIa86	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa87	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa88	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>
40 IIa89	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>
IIa90	OC(O)-c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	c-C <sub>3</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>

- i-C<sub>3</sub>H<sub>7</sub>: Isopropyl  
 c-C<sub>3</sub>H<sub>5</sub>: Cyclopropyl  
 t-C<sub>4</sub>H<sub>9</sub>: tertiar-Butyl  
 45 C<sub>6</sub>H<sub>5</sub>: Phenyl  
 3-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>F: 3-Fluorophenyl  
 4-C<sub>6</sub>H<sub>4</sub>CH<sub>3</sub>: 4-Methylphenyl

Tabelle A: Besonders bevorzugte Kombinationen von R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> und R<sup>3</sup>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	1 H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	2 F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	3 Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	4 Br	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10	5 OH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	6 SH	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	7 NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	8 CN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15	9 NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	10 SCN	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	11 NH-NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	12 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	13 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	14 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	15 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	16 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25	17 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	18 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	19 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	20 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	21 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	22 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	23 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	24 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35	25 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	62 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	27 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	28 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40	29 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	30 OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	31 OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	32 O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45	33 O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	34 O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	35 O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	36 O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## 43

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	
37	O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
38	OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
5	OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
40	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
41	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
42	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
10	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
44	S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
45	S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
15	S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
47	S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
18	48	S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
49	S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
20	50	SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
51	SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
25	52	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
53	SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
54	NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
55	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
25	56	NH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
57	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
58	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
59	N(Phenyl) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
30	60	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
61	Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
62	2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
63	3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
64	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
35	65	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
66	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
67	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
68	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
40	69	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
70	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
71	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
72	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
45	73	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
74	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	
75	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	

## 44

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
76	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
77	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 78	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
79	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
80	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
81	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10 82	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
83	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
84	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
85	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 86	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
87	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
88	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
89	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
90	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20 91	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
92	3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
93	4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
94	5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25 95	6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
96	2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
97	4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
98	5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30 99	6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
100	2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
101	3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
102	3'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35 103	4'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
104	5'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
105	6'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
106	2'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40 107	4'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
108	5'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
109	6'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
110	2'-Cl-4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
111	3'-Cl-4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45 112	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
113	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
114	Morpholino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## 45

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	115 CO <sub>2</sub> H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	116 CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	117 CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	118 CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	119 CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	120 CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10	121 CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	122 CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	123 CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	124 CO <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	125 CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	126 CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15	127 CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	128 CONHPh	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	129 CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	130 CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	131 CON(Phenyl) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	132 H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	133 F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	134 Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	135 Br	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	136 OH	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	137 SH	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	138 NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25	139 CN	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	140 NO <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	141 SCN	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	142 NH-NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	143 CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	144 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	145 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	146 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	147 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	148 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	149 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	150 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35	151 CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	152 CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	153 CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## 46

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
154	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
155	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
156	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
157	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
158	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
159	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
160	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
161	OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
162	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
163	O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
164	O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
165	O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
166	O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
167	O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
168	O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
169	OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
170	OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
171	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
172	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
173	SCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
174	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
175	S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
176	S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
177	S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
178	S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
179	S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
180	S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
181	SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
182	SCF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
183	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
184	SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
185	NHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
186	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
187	NHPhenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
188	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
189	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
190	N(Phenyl) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
191	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
192	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	193 2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	194 3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	195 4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	196 2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	197 3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	198 4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10	199 2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	200 3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	201 4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	202 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	203 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	204 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15	205 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	206 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	207 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	208 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	209 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	210 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	211 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	212 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	213 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	214 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	215 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	216 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25	217 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	218 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	219 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	220 2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	221 3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	222 4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	223 3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	224 4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	225 5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	226 6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	227 2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	228 4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35	229 5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	230 6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	231 2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## 48

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	232 3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	233 3'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	234 4'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	235 5'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	236 6'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	237 2'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10	238 4'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	239 5'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	240 6'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	241 2'-Cl-4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	242 3'-Cl-4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	243 Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15	244 Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	245 Morpholino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	246 CO <sub>2</sub> H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	247 CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	248 CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	249 CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	250 CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	251 CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	252 CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	253 CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	254 CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	255 CO <sub>2</sub> -Ph	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25	256 CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	257 CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	258 CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	259 CONHPhenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	260 CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	261 CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	262 CON(Phenyl) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	263 H	Cl	CH <sub>3</sub>
	264 F	Cl	CH <sub>3</sub>
	265 Cl	Cl	CH <sub>3</sub>
	266 Br	Cl	CH <sub>3</sub>
	267 OH	Cl	CH <sub>3</sub>
35	268 SH	Cl	CH <sub>3</sub>
	269 NH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
	270 CN	Cl	CH <sub>3</sub>

## 49

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	271 NO <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	272 SCN	C1	CH <sub>3</sub>
	273 NH-NH <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	274 CH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	275 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	276 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
10	277 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	278 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	279 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	280 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	281 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	282 CH <sub>2</sub> Cl	C1	CH <sub>3</sub>
15	283 CHCl <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	284 CCl <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	285 CH <sub>2</sub> F	C1	CH <sub>3</sub>
	286 CHF <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	287 CF <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	288 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
20	289 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	290 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	291 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	292 OCH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	293 OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	294 O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
25	295 O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	296 O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	297 O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	298 O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	299 O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	300 OCHF <sub>2</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
30	301 OCF <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	302 OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	303 OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	304 SCH <sub>3</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	305 SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	306 S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
35	307 S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	308 S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>
	309 S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	C1	CH <sub>3</sub>

## 50

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
310	S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
311	S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
5 312	SCHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
313	SCF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
314	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
315	SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
10 316	NHCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
317	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
318	NH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
15 319	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
320	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
15 321	N(Phenyl) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
322	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
323	Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
324	2-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
20 325	3-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
362	4-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
327	2-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
328	3-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
25 329	4-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
330	2-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
331	3-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
332	4-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
333	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
30 334	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
335	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
336	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
337	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
35 338	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
339	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
340	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
341	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
40 342	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
343	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
344	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
345	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
45 346	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
347	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
348	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>

## 51

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
349	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
350	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
5	351 2-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
352	3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
353	4-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
354	3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
10	355 4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
356	5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
357	6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
15	358 2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
359	4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
360	5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
361	6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
362	2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
20	363 3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
364	3'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
365	4'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
366	5'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
367	6'-Cl-2-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
25	368 2'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
369	4'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
370	5'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
371	6'-Cl-3-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
372	2'-Cl-4-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
30	373 3'-Cl-4-pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>
374	Cyclohexylamino	Cl	CH <sub>3</sub>
375	Cyclopentylamino	Cl	CH <sub>3</sub>
376	Morpholino	Cl	CH <sub>3</sub>
35	377 CO <sub>2</sub> H	Cl	CH <sub>3</sub>
378	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
379	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
380	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
40	381 CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
382	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
383	CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
384	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
45	385 CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
386	CO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
387	CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>

## 52

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	388 CONHCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
	389 CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
	390 CONH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>
	391 CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
	392 CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
	393 CON(Phenyl) <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>
10	394 H	CH <sub>3</sub>	H
	394 F	CH <sub>3</sub>	H
	396 Cl	CH <sub>3</sub>	H
	397 Br	CH <sub>3</sub>	H
	398 OH	CH <sub>3</sub>	H
	399 SH	CH <sub>3</sub>	H
15	400 NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	401 CN	CH <sub>3</sub>	H
	402 NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	403 SCN	CH <sub>3</sub>	H
	404 NH-NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	405 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
20	406 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	407 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	408 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	409 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	410 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	411 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
25	412 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	413 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	H
	414 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	415 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	416 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	H
	417 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
30	418 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	419 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	420 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	421 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	422 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	423 OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
35	424 OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	425 O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	462 O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	427 O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	428 O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	429 O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	430 O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	431 OCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
10	432 OCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	433 OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	434 OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	435 SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	436 SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
15	437 S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	438 S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	439 S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	440 S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	441 S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
20	442 S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	443 SCHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	444 SCF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	445 SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	446 SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
25	447 NHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	448 NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	449 NH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	450 N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	451 N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
30	452 N(Phenyl) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	453 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
	454 Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	455 2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	456 3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
35	457 4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	458 2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	459 3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	460 4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	461 2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
40	462 3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	463 4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	464 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	465 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H

## 54

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	466 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	467 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	468 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	469 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	470 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	471 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
10	472 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	473 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	474 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	475 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	476 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	477 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
15	478 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	479 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	480 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	481 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
	482 2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	483 3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
20	484 4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	485 3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	486 4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	487 5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	488 6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	489 2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
25	490 4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	491 5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	492 6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	493 2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	494 3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	495 3'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
30	496 4'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	497 5'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	498 6'-Cl-2-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	499 2'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	500 4'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	501 5'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
35	502 6'-Cl-3-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	503 2'-Cl-4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
	504 3'-Cl-4-pyridyl	CH <sub>3</sub>	H

## 55

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
505	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	H
506	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	H
507	Morpholino	CH <sub>3</sub>	H
508	CO <sub>2</sub> H	CH <sub>3</sub>	H
509	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
510	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
511	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
512	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H
513	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
514	CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
515	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
516	CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H
517	CO <sub>2</sub> -Ph	CH <sub>3</sub>	H
518	CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H
519	CONHCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
520	CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H
521	CONH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H
522	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
523	CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
524	CON(Phenyl) <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H
525	H	OCH <sub>3</sub>	H
526	F	OCH <sub>3</sub>	H
527	Cl	OCH <sub>3</sub>	H
528	Br	OCH <sub>3</sub>	H
529	OH	OCH <sub>3</sub>	H
530	SH	OCH <sub>3</sub>	H
531	NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
532	CN	OCH <sub>3</sub>	H
533	NO <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
534	SCN	OCH <sub>3</sub>	H
535	NH-NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
536	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
537	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
538	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
539	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
540	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
541	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
542	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
543	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H

## 56

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	544 CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	H
	545 CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	546 CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	547 CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	H
	548 CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	549 CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
10	550 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	551 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	552 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	553 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	554 OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
15	555 OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	556 O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	557 O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	558 O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
20	559 O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	560 O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	561 O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	562 OCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
25	563 OCF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	564 OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	565 OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	566 SCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
30	567 SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	568 S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	569 S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	570 S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	571 S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
35	572 S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	573 S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	574 SCHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	575 SCF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
40	576 SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	577 SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	578 NHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	579 NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	580 NHPh	OCH <sub>3</sub>	H
45	581 N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	582 N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
5	583 N(Phenyl) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	584 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
	585 Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	586 2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	587 3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	588 4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
10	589 2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	590 3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	591 4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	592 2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	593 3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
15	594 4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	595 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	596 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	597 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
20	598 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	599 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	600 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	601 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
25	602 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	603 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	604 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	605 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
30	606 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	607 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	608 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	609 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	610 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
35	611 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	612 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
	613 2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	614 3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
40	615 4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	616 3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	617 4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	618 5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	619 6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
45	620 2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
	621 4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H

## 58

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
622	5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
623	6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
624	2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
625	3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
626	3'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
627	4'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
628	5'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
629	6'-Cl-2-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
630	2'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
631	4'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
632	5'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
633	6'-Cl-3-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
634	2'-Cl-4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
635	3'-Cl-4-pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
636	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	H
637	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	H
638	Morpholino	OCH <sub>3</sub>	H
639	CO <sub>2</sub> H	OCH <sub>3</sub>	H
640	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
641	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
642	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
643	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
644	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
645	CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
646	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
647	CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
648	CO <sub>2</sub> -Ph	OCH <sub>3</sub>	H
649	CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H
650	CONHCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
651	CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
652	CONH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H
653	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
654	CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
655	CON(Phenyl) <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H
656	H	Cl	H
657	F	Cl	H
658	Cl	Cl	H
659	Br	Cl	H
660	OH	Cl	H

## 59

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
661	SH	Cl	H
662	NH <sub>2</sub>	Cl	H
663	CN	Cl	H
664	NO <sub>2</sub>	Cl	H
665	SCN	Cl	H
666	NH-NH <sub>2</sub>	Cl	H
667	CH <sub>3</sub>	Cl	H
668	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H
669	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
670	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
671	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
672	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
673	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
674	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
675	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	H
676	CHCl <sub>2</sub>	Cl	H
677	CCl <sub>3</sub>	Cl	H
678	CH <sub>2</sub> F	Cl	H
679	CHF <sub>2</sub>	Cl	H
680	CF <sub>3</sub>	Cl	H
681	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H
682	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H
683	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H
684	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	H
685	OCH <sub>3</sub>	Cl	H
686	OC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H
687	O-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
688	O-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
689	O-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
690	O-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
691	O-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
692	O-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
693	OCHF <sub>2</sub>	Cl	H
694	OCF <sub>3</sub>	Cl	H
695	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H
696	OCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H
697	SCH <sub>3</sub>	Cl	H
698	SC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H
699	S-n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H

## 60

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
700	S-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
701	S-n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
5 702	S-s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
703	S-i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
704	S-t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
705	SCHF <sub>2</sub>	Cl	H
10 706	SCF <sub>3</sub>	Cl	H
707	SCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H
708	SCH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H
709	NHCH <sub>3</sub>	Cl	H
15 710	NHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H
711	NHPh	Cl	H
712	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	H
713	N(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	H
714	N(Phenyl) <sub>2</sub>	Cl	H
20 715	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	H
716	Phenyl	Cl	H
717	2-F-Phenyl	Cl	H
718	3-F-Phenyl	Cl	H
25 719	4-F-Phenyl	Cl	H
720	2-Cl-Phenyl	Cl	H
721	3-Cl-Phenyl	Cl	H
722	4-Cl-Phenyl	Cl	H
30 723	2-OH-Phenyl	Cl	H
724	3-OH-Phenyl	Cl	H
725	4-OH-Phenyl	Cl	H
726	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
727	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
35 728	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
729	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
730	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
731	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
40 732	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H
733	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H
734	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H
735	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
45 736	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
737	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H
738	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H

## 61

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	
739	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	
740	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	
5	741	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H
742	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	
743	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	
10	744	2-Pyridyl	Cl	H
745	3-Pyridyl	Cl	H	
15	746	4-Pyridyl	Cl	H
747	3'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	H	
748	4'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	H	
15	749	5'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	H
750	6'-CH <sub>3</sub> -2-pyridyl	Cl	H	
20	751	2'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	H
752	4'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	H	
753	5'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	H	
20	754	6'-CH <sub>3</sub> -3-pyridyl	Cl	H
755	2'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	Cl	H	
756	3'-CH <sub>3</sub> -4-pyridyl	Cl	H	
25	757	3'-Cl-2-pyridyl	Cl	H
758	4'-Cl-2-pyridyl	Cl	H	
759	5'-Cl-2-pyridyl	Cl	H	
760	6'-Cl-2-pyridyl	Cl	H	
761	2'-Cl-3-pyridyl	Cl	H	
30	762	4'-Cl-3-pyridyl	Cl	H
763	5'-Cl-3-pyridyl	Cl	H	
764	6'-Cl-3-pyridyl	Cl	H	
30	765	2'-Cl-4-pyridyl	Cl	H
766	3'-Cl-4-pyridyl	Cl	H	
35	767	Cyclohexylamino	Cl	H
768	Cyclopentylamino	Cl	H	
769	Morpholino	Cl	H	
40	770	CO <sub>2</sub> H	Cl	H
771	CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	
772	CO <sub>2</sub> C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	
773	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	
45	774	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H
775	CO <sub>2</sub> -n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	
776	CO <sub>2</sub> -s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	
777	CO <sub>2</sub> -i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	

## 62

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>
778	CO <sub>2</sub> -t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H
779	CO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H
5 780	CO <sub>2</sub> -3-Pyridyl	Cl	H
781	CONHCH <sub>3</sub>	Cl	H
782	CONHC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H
783	CONH-Phenyl	Cl	H
10 784	CON(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	H
785	CON(CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	Cl	H
786	CON(Phenyl) <sub>2</sub>	Cl	H
15 787	2-Fluorophenoxy	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
788	2-Fluorophenoxy	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 789	2-Fluorophenoxy	Cl	CH <sub>3</sub>
790	2-Fluorophenoxy	CH <sub>3</sub>	H
791	2-Fluorophenoxy	OCH <sub>3</sub>	H
792	2-Fluorophenoxy	Cl	H
20 793	Phenoxy	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
794	Phenoxy	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
795	Phenoxy	Cl	CH <sub>3</sub>
796	Phenoxy	CH <sub>3</sub>	H
25 797	Phenoxy	OCH <sub>3</sub>	H
798	Phenoxy	Cl	H
799	2-Methoxyphenoxy	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
800	2-Methoxyphenoxy	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30 801	2-Methoxyphenoxy	Cl	CH <sub>3</sub>
802	2-Methoxyphenoxy	CH <sub>3</sub>	H
803	2-Methoxyphenoxy	OCH <sub>3</sub>	H
804	2-Methoxyphenoxy	Cl	H
35 805	Cyclopropyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
806	Cyclopropyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
807	Cyclopropyl	Cl	CH <sub>3</sub>
808	Cyclopropyl	CH <sub>3</sub>	H
35 809	Cyclopropyl	OCH <sub>3</sub>	H
40 810	Cyclopropyl	Cl	H

Hier und im folgenden bedeuten beispielsweise:

2-F-Phenyl = 2-Fluorophenyl

45 2-Cl-Phenyl = 2-Chlorphenyl

2-OH-Phenyl = 2-Hydroxyphenyl

2-OCH<sub>3</sub>-Phenyl = 2-Methoxyphenyl

**63**

2-OCF<sub>3</sub>-Phenyl = 2-Trifluormethoxyphenyl  
2-OCHF<sub>2</sub>-Phenyl = 2-Difluormethoxyphenyl  
2-NO<sub>2</sub>-Phenyl = 2-Nitrophenyl  
3'-CH<sub>3</sub>-2-pyridyl = 3'-Methylpyridin-2-yl

**5**

**10**

**15**

**20**

**25**

**30**

**35**

**40**

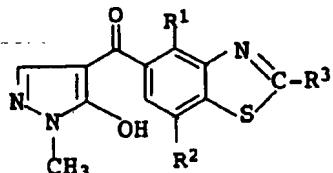
**45**

64

Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Benzothiazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Pyrazolen (Verbindungen I-1 = Verbindungen I mit X = C-R<sup>3</sup> und Y = S) sind die in den Tabellen 2 bis 5 21 genannten Verbindungen.

- Tabelle 2: Verbindungen I-1a.1 bis I-1a.810

10



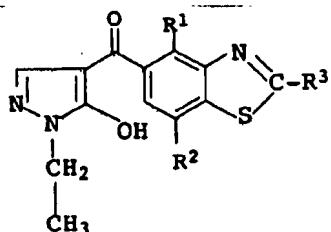
15

I-1a

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1a, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer 20 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 3: Verbindungen I-1b.1 bis I-1b.810

25



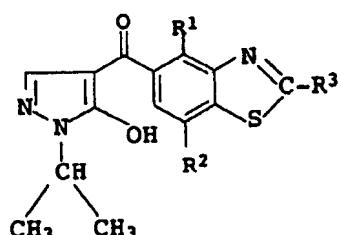
30

I-1b

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer 35 Zeile der Tabelle A entsprechen.

- Tabelle 4: Verbindungen I-1c.1 bis I-1c.810

40



45

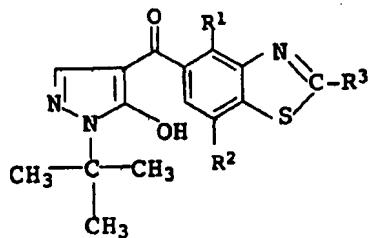
I-1c

65

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1c, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

**5 - Tabelle 5: Verbindungen I-1d.1 bis I-1d.810**

10



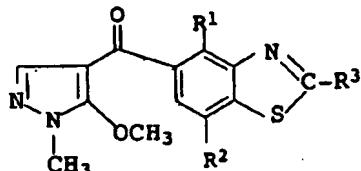
I-1d

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

**20 - Tabelle 6: Verbindungen I-1e.1 bis I-1e.810**

25



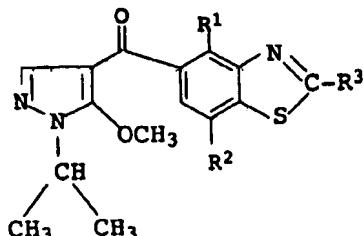
I-1e

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1e, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

**35 - Tabelle 7: Verbindungen I-1f.1 bis I-1f.810**

40



I-1f

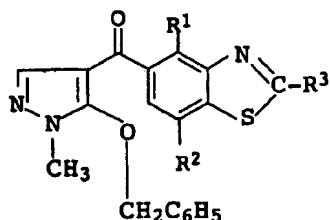
45

## 66

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1f, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 8: Verbindungen I-1g.1 bis I-1g.810

10



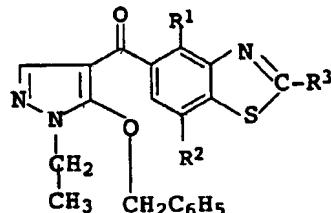
I-1g

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1g, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 9: Verbindungen I-1h.1 bis I-1h.810

25



I-1h

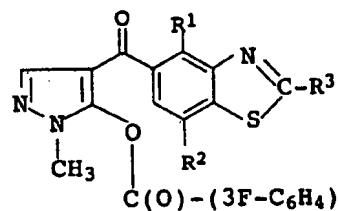
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1h, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35

- Tabelle 10: Verbindungen I-1i.1 bis I-1i.810

40



I-1i

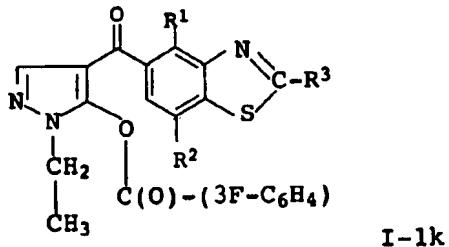
45

67

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1i, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 11: Verbindungen I-1k.1 bis I-1k.810

10

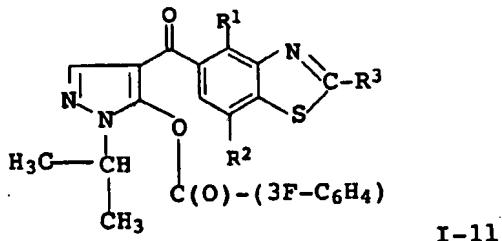


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1k, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 12: Verbindungen I-1l.1 bis I-1l.810

25

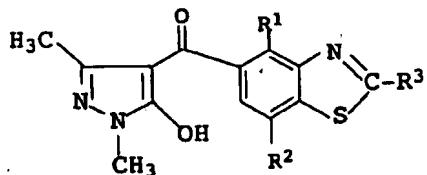


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1l, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 13: Verbindungen I-1m.1 bis I-1m.810

40



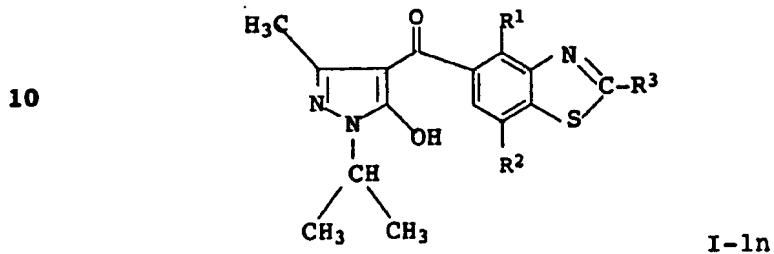
I-1m

45

68

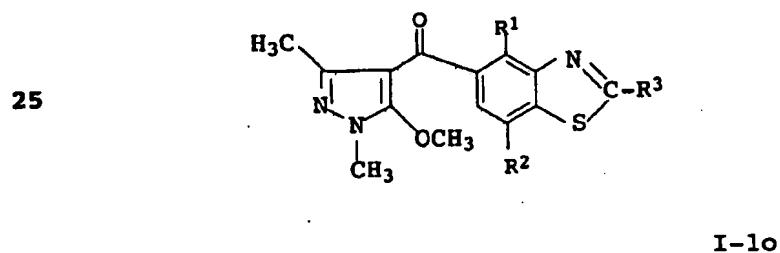
Verbindungen der allgemeinen Formel I-1m, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 14: Verbindungen I-1n.1 bis I-1n.810



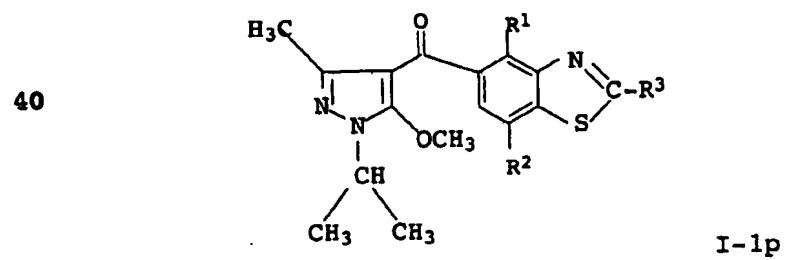
15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1n, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 15: Verbindungen I-1o.1 bis I-1o.810



30 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1p, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 16: Verbindungen I-1p.1 bis I-1p.810



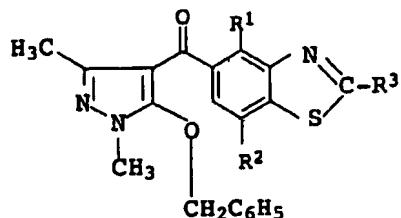
45

69

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1p, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 17: Verbindungen I-1q.1 bis I-1q.810

10



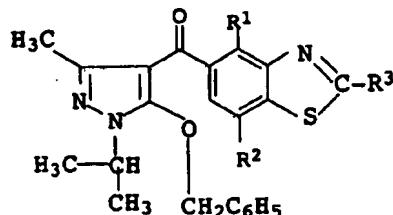
I-1q

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1q, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 18: Verbindungen I-1r.1 bis I-1r.810

25



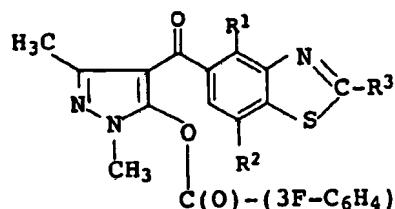
I-1r

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1r, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 19: Verbindungen I-1s.1 bis I-1s.810

40



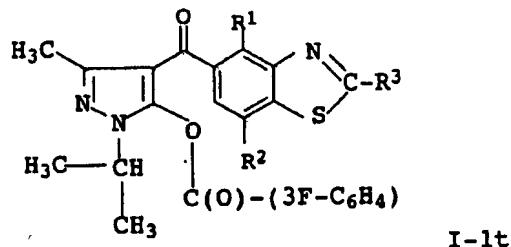
I-1s

45

70  
 Verbindungen der allgemeinen Formel I-1s, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 20: Verbindungen I-1t.1 bis I-1t.810

10



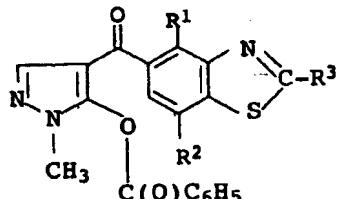
15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1t, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20

Tabelle 20a: Verbindungen I-1u.1 bis I-1u.810

25



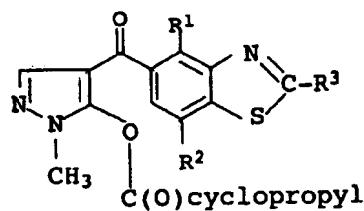
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1u, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35

Tabelle 20b: Verbindungen I-1v.1 bis I-1v.810

40



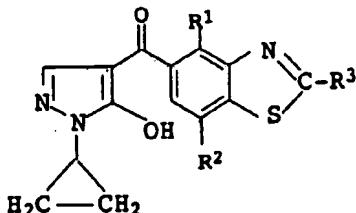
45

71

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1v, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 20c: Verbindungen I-1w.1 bis I-1w.810

10



I-1w

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1w, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

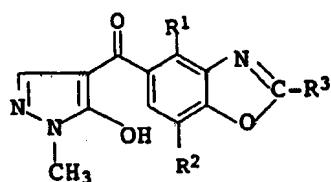
20 Beispiele für erfindungsgemäß besonders bevorzugte Pyrazolylderivate sind sind die Benzothiazol-S-dioxidverbindungen 1-1'a.1 bis 1-1'a.810, 1-1'b.1 bis 1-1'b.810, ..... 1-1'w.1 bis 1-1'w.810 (Verbindungen I-1' = Verbindungen I mit X = C-R3 und Y = SO2). Sie unterscheiden sich von den in den Tabellen 1 bis 21 aufgeführten Benzothiazolverbindungen 1-1a.1 bis 1-1a.810, 1-1b.1 bis 1-1b.810, ..... 1-1w.1 bis 1-1w.810 darin, daß das heterocyclische Schwefelatom als SO2-Gruppe vorliegt.

Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Pyrazolylderivate von Benzoxazol-5-carbonylverbindungen (Verbindungen I-2 = Verbindungen I mit X = C-R3 und Y = O) sind die in den Tabellen 21 bis 40 genannten Verbindungen.

- Tabelle 21: Verbindungen I-2a.1 bis I-2a.810

35

40



I-2a

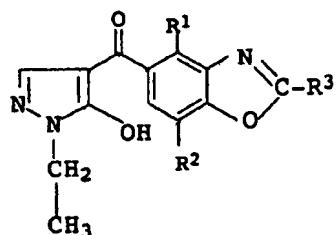
45

72

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2a, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 22: Verbindungen I-2b.1 bis I-2b.810

10



I-2b

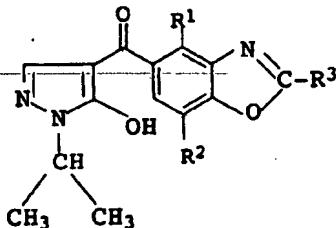
15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20

Tabelle 23: Verbindungen I-2c.1 bis I-2c.810

25



I-2c

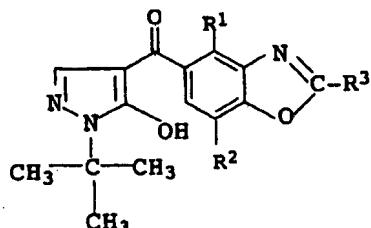
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2c, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35

- Tabelle 24: Verbindungen I-2d.1 bis I-2d.810

40



I-2d

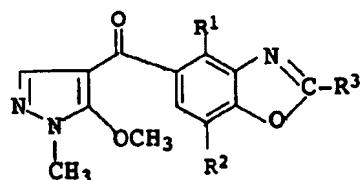
45

73

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2b, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 25: Verbindungen I-2e.1 bis I-2e.810

10



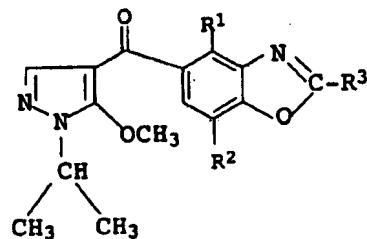
I-1e

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-1e, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 26: Verbindungen I-2f.1 bis I-2f.810

25



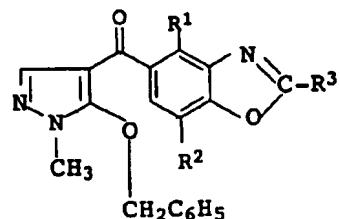
I-2f

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2f, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 27: Verbindungen I-2g.1 bis I-2g.810

40



I-2g

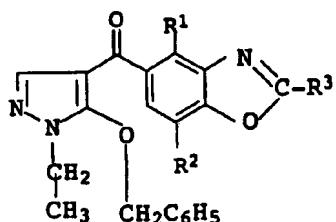
45

74

Verbindungen der allgemeinen Formel I-22g, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 28: Verbindungen I-2h.1 bis I-2h.810

10



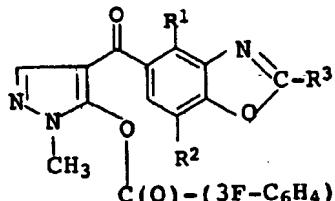
I-2h

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2h, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 29: Verbindungen I-2i.1 bis I-2i.810

25



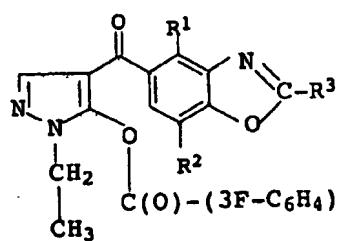
I-2i

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2i, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 30: Verbindungen I-2k.1 bis I-2k.810

40



I-2k

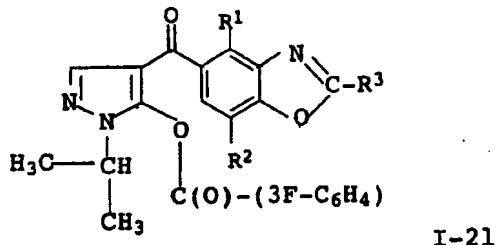
45

75

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2k, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 31: Verbindungen I-2l.1 bis I-2l.810

10

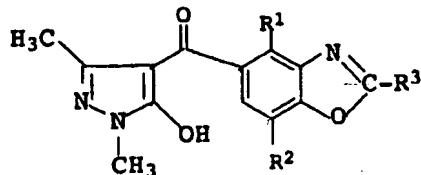


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2l, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 32: Verbindungen I-2m.1 bis I-2m.810

25

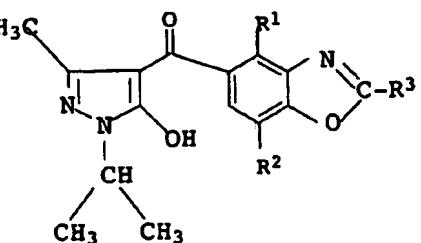


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2m, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 33: Verbindungen I-2n.1 bis I-2n.810

40



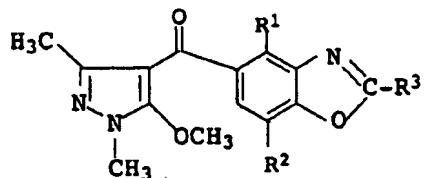
45

76

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2n, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 34: Verbindungen I-2o.1 bis I-2o.810

10



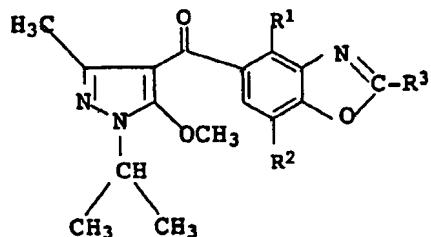
I-2o

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2o, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 35: Verbindungen I-2p.1 bis I-2p.810

25



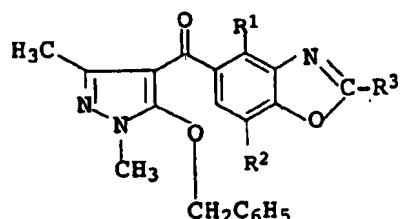
I-2p

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2p, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 36: Verbindungen I-2q.1 bis I-2q.810

40



I-2q

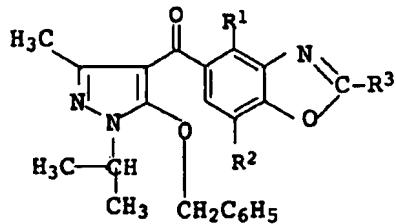
45

77

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2q, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 37: Verbindungen I-2r.1 bis I-2r.810

10



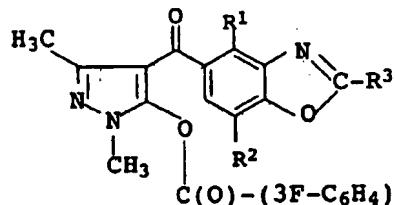
I-2r

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2r, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 38: Verbindungen I-2s.1 bis I-2s.810

25



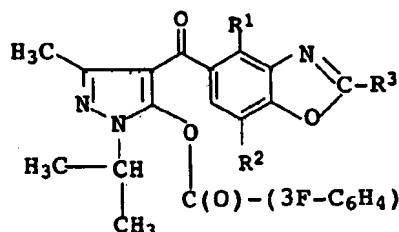
I-2s

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2s, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 39: Verbindungen I-2t.1 bis I-2t.810

40



I-2t

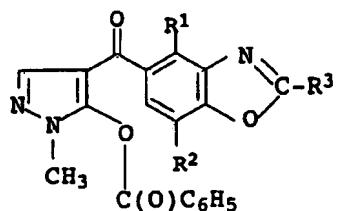
45

70

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2t, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 - Tabelle 39a: Verbindungen I-2u.1 bis I-2u.810

10



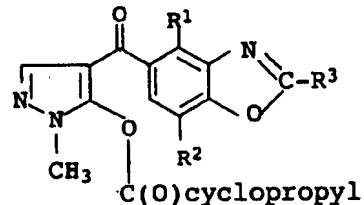
I-2u

15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2u, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

20 - Tabelle 39b: Verbindungen I-2v.1 bis I-2v.810

25



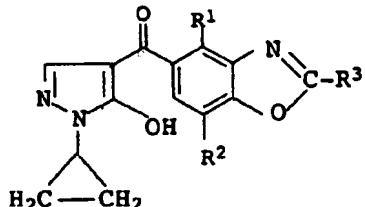
I-2v

30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2v, in der die Substituenten R1, R2 und R3 für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

35 - Tabelle 39c: Verbindungen I-2w.1 bis I-2w.810

40



I-2w

45

79

Verbindungen der allgemeinen Formel I-2w, in der die Substituenten R<sub>1</sub>, R<sub>2</sub> und R<sub>3</sub> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle A entsprechen.

5 In der folgenden Tabelle B sind besonders bevorzugte Kombinationen R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für erfindungsgemäße Pyrazolderivate der allgemeinen Formel I angegeben, die sich von Benzimidazol-5-carbonsäuren ableiten.

10

15

20

25

30

35

40

45

80

Tabelle B

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
1	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
2	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
3	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
4	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
10	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
5	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
6	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
7	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
8	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
15	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
9	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
10	CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
11	CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
12	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
13	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
20	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
14	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
15	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
16	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
25	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
17	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
18	Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
20	2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
21	3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
30	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
22	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
23	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
24	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
35	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
27	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
28	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
29	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
40	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
31	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
32	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
33	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
34	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
45	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
35	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
36				

61

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	
37	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
38	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
5	39	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
40	40	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
41	41	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
42	42	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
10	43	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
44	44	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
45	45	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
46	46	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
15	47	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
48	48	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
49	49	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
50	50	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
51	51	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
20	52	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
53	53	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
54	54	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
55	55	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
25	56	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
57	57	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
58	58	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
59	59	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
30	60	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
61	61	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
62	62	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
63	63	CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
64	64	CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
35	65	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
66	66	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
67	67	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
68	68	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
40	69	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
70	70	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
71	71	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
72	72	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
45	73	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
74	74	2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
75	75	3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H

82

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	
76	4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
77	2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
5	78	3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
79	4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
80	2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
81	3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
10	82	4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
83	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
84	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
85	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
15	86	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
87	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
88	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
89	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
90	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
20	91	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
92	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
93	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
94	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
25	95	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
96	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
97	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
98	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
30	99	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
00	100	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
101	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
102	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
103	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
35	104	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H
105	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	
106	H	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
107	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
40	108	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
109	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
110	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
111	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
45	112	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
113	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	
114	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H	

03

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
115	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
116	CHCl <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
5 117	CCl <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
118	CH <sub>2</sub> F	Cl	CH <sub>3</sub>	H
119	CHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
120	CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
10 121	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
122	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
123	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
124	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
125	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	H
15 126	Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
127	2-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
128	3-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
129	4-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
20 130	2-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
131	3-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
132	4-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
133	2-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
25 134	3-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
135	4-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
136	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
137	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
30 138	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
139	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
140	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
141	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
35 142	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
143	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
144	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
145	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
40 146	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
147	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
148	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
149	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
150	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
45 151	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
152	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
153	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H

84

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	154 2-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
	155 3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
	156 4-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	H
	157 Cyclohexylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	H
	158 Cyclopentylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	H
	159 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
10	160 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	161 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	162 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	163 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	164 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	165 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
15	166 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	167 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	H	H
	168 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	169 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	170 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	H	H
	171 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
20	172 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	173 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	174 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	175 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	176 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
	177 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H
25	178 Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	179 2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	180 3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	181 4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	182 2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	183 3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
30	184 4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	185 2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	186 3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	187 4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	188 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	189 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
35	190 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	191 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
	192 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H

85

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
193	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
194	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
5 195	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
196	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
197	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
198	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
10 199	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
200	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
201	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
202	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
15 203	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
204	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
205	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	H
206	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	H
207	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	H
20 208	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	H
209	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	H	H
210	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	H	H
211	H	OCH <sub>3</sub>	H	H
25 212	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
213	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
214	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
215	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
30 216	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
217	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
218	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
219	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
220	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	H	H
35 221	CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
222	CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
223	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	H	H
224	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
40 225	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
226	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
227	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
228	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
45 229	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
230	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	H
231	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H

86

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
232	3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
233	4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
234	2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
235	3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
236	4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
10	2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
237	3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
238	4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
239	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
240	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
15	241 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
242	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
243	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
244	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
245	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
246	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
20	247 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
248	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
249	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
250	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
251	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
252	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
253	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
254	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
255	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
30	256 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
257	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
258	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
259	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
35	260 3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
261	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	H
262	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	H	H
263	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	H	H
40	264 H	Cl	H	H
265	CH <sub>3</sub>	Cl	H	H
266	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	H
267	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	H
268	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	H
45	269 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	H
270	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	H

67

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
271	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	H
272	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	H
5	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	H	H
274	CHCl <sub>2</sub>	Cl	H	H
275	CCl <sub>3</sub>	Cl	H	H
276	CH <sub>2</sub> F	Cl	H	H
10	CHF <sub>2</sub>	Cl	H	H
278	CF <sub>3</sub>	Cl	H	H
279	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H	H
280	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H	H
15	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	H
282	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	H	H
283	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	H	H
284	Phenyl	Cl	H	H
285	2-F-Phenyl	Cl	H	H
20	286 3-F-Phenyl	Cl	H	H
287	4-F-Phenyl	Cl	H	H
288	2-Cl-Phenyl	Cl	H	H
289	3-Cl-Phenyl	Cl	H	H
25	290 4-Cl-Phenyl	Cl	H	H
291	2-OH-Phenyl	Cl	H	H
292	3-OH-Phenyl	Cl	H	H
293	4-OH-Phenyl	Cl	H	H
30	294 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
295	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
296	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
297	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
298	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
35	299 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
300	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H
301	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H
302	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H
40	303 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
304	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
305	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
306	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
45	307 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
308	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	H
309	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H
	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	H
	2-Pyridyl	Cl	H	H
	3-Pyridyl	Cl	H	H
	4-Pyridyl	Cl	H	H
10	Cyclohexylamino	Cl	H	H
	Cyclopentylamino	Cl	H	H
	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35	3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
349	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
350	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 351	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
352	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
353	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10 354	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
355	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 356	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
357	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
358	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 359	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
360	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
361	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
362	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
363	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20 364	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
365	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
366	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
367	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25 368	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
369	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
370	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
371	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30 372	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
373	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
374	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
375	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
376	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35 377	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
378	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
379	CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
380	CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40 381	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
382	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
383	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
384	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45 385	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
386	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
387	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

90

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
388	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
389	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
5 390	2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
391	3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
392	4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
393	2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
10 394	3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
395	4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
396	2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
397	3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
15 398	4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
399	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
400	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
401	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
402	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
20 403	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
404	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
405	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
406	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
25 407	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
408	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
409	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
410	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
30 411	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
412	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
413	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
414	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
415	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
35 416	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
417	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
418	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
419	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
40 420	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
421	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
422	H	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
423	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
424	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
45 445	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
426	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

91

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
427	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
428	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
429	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
430	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
431	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
432	CHCl <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
433	CCl <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
434	CH <sub>2</sub> F	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
435	CHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
436	CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
437	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
438	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
439	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
440	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
441	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
442	Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
443	2-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
444	3-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
445	4-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
446	2=Cl=Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
447	3-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
448	4-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
449	2-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
450	3-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
451	4-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
452	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
453	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
454	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
455	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
456	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
457	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
458	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
459	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
460	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
461	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
462	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
463	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
464	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
465	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>

## 92

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
466	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
467	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
468	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
469	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
470	2-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
471	3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
472	4-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
473	Cyclohexylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
474	Cyclopentylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
475	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
476	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
477	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
478	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
479	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
480	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
481	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
482	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
483	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
484	CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
485	CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
486	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
487	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
488	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
489	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
490	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
491	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
492	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
493	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
494	Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
495	2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
496	3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
497	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
498	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
499	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
500	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
501	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
502	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
503	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
504	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>

## g3

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	505 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	506 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	507 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	508 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	509 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	510 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
10	511 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	512 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	513 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	514 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	515 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	516 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
15	517 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	518 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	519 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	520 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	521 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	522 2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
20	523 3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	524 4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	525 Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	526 Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	527 H	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	528 CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
25	529 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	530 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	531 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	532 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	533 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	534 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
30	535 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	536 CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	537 CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	538 CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	539 CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	540 CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
35	541 CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	542 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
	543 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
544	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
545	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
546	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
547	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
548	2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
549	3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
550	4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
551	2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
552	3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
553	4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
554	2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
555	3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
556	4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
557	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
558	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
559	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
560	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
561	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
562	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
563	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
564	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
565	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
566	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
567	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
568	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
569	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
570	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
571	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
572	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
573	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
574	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
575	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
576	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
577	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
578	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
579	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>
580	H	Cl	H	CH <sub>3</sub>
581	CH <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
582	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>

95

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
583	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
584	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
585	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
586	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
587	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
588	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
589	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
590	CHCl <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
591	CCl <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
592	CH <sub>2</sub> F	Cl	H	CH <sub>3</sub>
593	CHF <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
594	CF <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
595	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
596	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
597	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
598	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
599	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	H	CH <sub>3</sub>
600	Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
701	2-F-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
702	3=F=Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
703	4-F-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
704	2-Cl-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
705	3-Cl-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
706	4-Cl-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
707	2-OH-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
708	3-OH-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
709	4-OH-Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
710	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
711	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
712	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
713	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
714	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
715	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
716	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
717	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
718	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
719	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
720	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
721	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	722 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	723 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	724 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	725 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	726 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	727 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
10	728 2-Pyridyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	729 3-Pyridyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	730 4-Pyridyl	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	731 Cyclohexylamino	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	732 Cyclopentylamino	Cl	H	CH <sub>3</sub>
	733 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15	734 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	735 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	736 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	737 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	738 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	739 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20	740 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	741 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	742 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	743 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	744 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	745 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
25	746 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	747 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	748 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	749 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	750 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	751 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30	752 Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	753 2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	754 3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	755 4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	756 2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	757 3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35	758 4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	759 2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	760 3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
761	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
5 762	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
763	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
764	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10 765	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
766	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15 767	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
768	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
769	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
770	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15 771	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
772	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
773	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
774	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20 775	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
776	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
777	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
778	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
25 779	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
780	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
781	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
782	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30 783	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
784	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
785	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
786	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
787	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35 788	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
789	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
790	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
791	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
40 792	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
793	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
794	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
795	CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45 796	CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
797	CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
798	CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

98

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
799	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
800	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
5 801	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
802	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
803	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
804	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10 805	Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
806	2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
807	3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
808	4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15 809	2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
810	3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
811	4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
812	2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
813	3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20 814	4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
815	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
816	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
817	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
25 818	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
819	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
820	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
821	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30 822	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
823	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
824	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
825	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
826	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35 827	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
828	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
829	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
830	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
40 831	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
832	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
833	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
834	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45 835	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
836	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
837	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

99

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
838	H	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
839	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
5 840	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
841	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
842	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
843	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10 844	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
845	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
846	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
847	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15 848	CHCl <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
849	CCl <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
850	CH <sub>2</sub> F	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
851	CHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
18 852	CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20 853	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
854	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
855	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
856	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
25 857	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
858	Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
859	2-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
860	3-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30 861	4-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
862	2-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
863	3-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
864	4-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35 865	2-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
866	3-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
867	4-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
868	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
40 869	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
870	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
871	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
872	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
873	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45 874	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
875	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
876	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

100

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
877	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
878	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
879	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
880	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
881	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
882	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
883	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
884	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
885	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
886	2-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
887	3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
888	4-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
889	Cyclohexylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
890	Cyclopentylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
891	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
892	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
893	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
894	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
895	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
896	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
897	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
898	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
899	CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
900	CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
901	CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
902	CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
903	CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
904	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
905	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
906	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
907	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
908	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
909	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
910	Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
911	2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
912	3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
913	4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
914	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
915	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

101

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
916	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
917	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
918	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
919	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
920	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
921	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
922	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
923	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
924	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
925	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
926	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
927	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
928	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
929	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
930	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
931	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
932	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
933	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
934	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
935	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
936	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
937	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
938	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
939	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
940	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
941	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
942	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
943	H	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
944	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
945	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
946	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
947	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
948	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
949	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
950	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
951	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
952	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
953	CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
954	CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

102

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	955 CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	956 CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10	957 CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	958 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15	959 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	960 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20	961 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	962 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
25	963 Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	964 2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30	965 3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	966 4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35	967 2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	968 3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
40	969 4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	970 2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45	971 3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	972 4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	973 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	974 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	975 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	976 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	977 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	978 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	979 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	980 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	981 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	982 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	983 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	984 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	985 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	986 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	987 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	988 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	989 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	990 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	991 2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	992 3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	993 4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

103

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
994	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
995	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
5 996	H	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
997	CH <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
998	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
999	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1000	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1001	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1002	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1003	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1004	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1005	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1006	CHCl <sub>2</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1007	CCl <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1008	CH <sub>2</sub> F	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1009	CHF <sub>2</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1010	CF <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1011	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1012	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1013	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1014	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1015	Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1016	2-F-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
30 1017	3-F-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1018	4-F-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1019	2-Cl-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1020	3-Cl-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
35 1021	4-Cl-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1022	2-OH-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1023	3-OH-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1024	4-OH-Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
40 1025	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1026	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1027	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1028	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45 1029	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1030	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
1031	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

104

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1032 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1033 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1034 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1035 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1036 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1037 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10	1038 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1039 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1040 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1041 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1042 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1043 2-Pyridyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15	1044 3-Pyridyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1045 4-Pyridyl	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1046 Cyclohexylamino	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1047 Cyclopentylamino	Cl	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1048 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1049 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	1050 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1051 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1052 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1053 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1054 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1055 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	1056 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1057 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1058 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1059 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1060 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1061 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
30	1062 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1063 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1064 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1065 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1066 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1067 Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
35	1068 2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1069 3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1070 4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

105

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	
1071	2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1072	3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
5	1073	4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1074	2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1075	3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1076	4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
10	1077	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1078	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1079	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1080	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
15	1081	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1082	4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1083	2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1084	3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
20	1085	4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1086	2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1087	3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1088	4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1089	2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
25	1090	3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1091	4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1092	2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1093	3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
30	1094	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1095	2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1096	3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1097	4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
35	1098	Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1099	Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1100	H	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1101	CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1102	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
40	1103	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1104	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1105	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1106	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
45	1107	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1108	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1109	CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	

106

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1110 CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1111 CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1112 CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1113 CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1114 CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
10	1115 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1116 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1117 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1118 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1119 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
15	1120 Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1121 2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1122 3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1123 4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1124 2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	1125 3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1126 4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1127 2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1128 3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1129 4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	1130 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1131 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1132 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1133 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1134 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
30	1135 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1136 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1137 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1138 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1139 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
35	1140 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1141 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1142 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1143 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1144 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
40	1145 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1146 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1147 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1148 2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

167

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	
1149	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1150	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
5	1151	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1152	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1153	H	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
10	1154	CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1155	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1156	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1157	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
15	1158	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1159	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1160	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1161	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1162	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
20	1163	CHCl <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1164	CCl <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1165	CH <sub>2</sub> F	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1166	CHF <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
25	1167	CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1168	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1169	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1170	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1171	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
30	1172	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1173	Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1174	2-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1175	3-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
35	1176	4-F-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1177	2-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1178	3-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1179	4-Cl-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
35	1180	2-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
40	1181	3-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1182	4-OH-Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1183	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1184	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
45	1185	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1186	2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1187	3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	

108

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1188 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1189 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1190 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1191 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1192 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
10	1193 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1194 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1195 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1196 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1197 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
15	1198 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1199 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1200 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1201 2-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1202 3-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	1203 4-Pyridyl	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1204 Cyclohexylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1205 Cyclopentylamino	Cl	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1206 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1207 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	1208 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1209 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1210 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1211 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1212 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
30	1213 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1214 CH <sub>2</sub> Cl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1215 CHCl <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1216 CCl <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1217 CH <sub>2</sub> F	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
35	1218 CHF <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1219 CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1220 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1221 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1222 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
40	1223 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1224 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1225 Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1226 2-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

## log

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1227 3-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1228 4-F-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1229 2-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1230 3-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1231 4-Cl-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1232 2-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
10	1233 3-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1234 4-OH-Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1235 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1236 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1237 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1238 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
15	1239 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1240 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1241 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1242 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1243 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1244 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	1245 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1246 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1247 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1248 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1249 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1250 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	1251 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1252 4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1253 2-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1254 3-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1255 4-Pyridyl	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1256 Cyclohexylamino	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
30	1257 Cyclopentylamino	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1258 H	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1259 CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1260 C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1261 n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1262 i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
35	1263 n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1264 s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1265 i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

110

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1266 t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1267 CH <sub>2</sub> Cl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1268 CHCl <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1269 CCl <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1270 CH <sub>2</sub> F	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1271 CHF <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
10	1272 CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1273 CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1274 CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1275 CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1276 CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1277 (CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
15	1278 Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1279 2-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1280 3-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1281 4-F-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1282 2-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1283 3-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	1284 4-Cl-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1285 2-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1286 3-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1287 4-OH-Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1288 2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1289 3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	1290 4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1291 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1292 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1293 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1294 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1295 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
30	1296 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1297 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1298 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1299 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1300 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1301 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
35	1302 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1303 2-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1304 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

III

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	
1305	4-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1306	2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
5	1307	3-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1308	4-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1309	Cyclohexylamino	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1310	Cyclopentylamino	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
10	1311	H	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1312	CH <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1313	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1314	n-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1315	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
15	1316	n-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1317	s-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1318	i-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1319	t-C <sub>4</sub> H <sub>9</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
20	1320	CH <sub>2</sub> Cl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1321	CHCl <sub>2</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1322	CH <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1323	CH <sub>2</sub> F	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
25	1324	CHF <sub>2</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1325	CF <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1326	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1327	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
30	1328	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1329	CH <sub>2</sub> NH <sub>2</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1330	(CH <sub>2</sub> ) <sub>2</sub> COCH <sub>3</sub>	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
35	1331	Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1332	2-F-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1333	3-F-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1334	4-F-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
40	1335	2-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1336	3-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1337	4-Cl-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1338	2-OH-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
45	1339	3-OH-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
1340	4-OH-Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1341	2-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1342	3-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	
1343	4-OCH <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>	

112

	R <sup>3</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>
5	1344 2-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	Cl	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1345 3-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1346 4-OCF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1347 2-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1348 3-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1349 4-OCHF <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
10	1350 2-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1351 3-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1352 4-CF <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1353 2-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1353 3-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1354 4-CH <sub>3</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
15	1355 H	CH <sub>3</sub>	H	H
	1356 3-NO <sub>2</sub> -Phenyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1357 H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>
	1358 2-Pyridyl	OCH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1359 H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	1360 H	CH <sub>3</sub>	H	C <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
20	1361 H	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1362 H	CH <sub>3</sub>	H	i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	1363 H	CH <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>

30

35

40

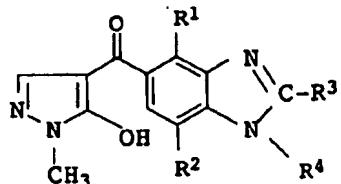
45

113

Beispiele für erfindungsgemäße besonders bevorzugte Benzimidazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Pyrazolen (Verbindungen I-3 = Verbindungen I mit X = C-R<sup>3</sup> und Y = N-R<sup>4</sup>) sind die in den Tabellen 40 bis 58 genannten Verbindungen.

- Tabelle 40: Verbindungen I-3a.1 bis I-3a.1363

10



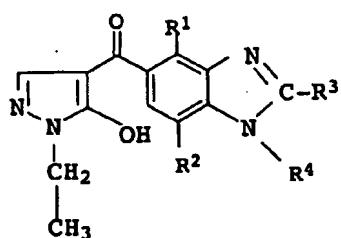
15

I-3a

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3a, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 41: Verbindungen I-3b.1 bis I-3b.1363

25



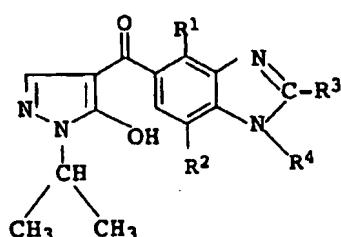
30

I-3b

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3b, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

- Tabelle 42: Verbindungen I-3c.1 bis I-3c.1363

40



45

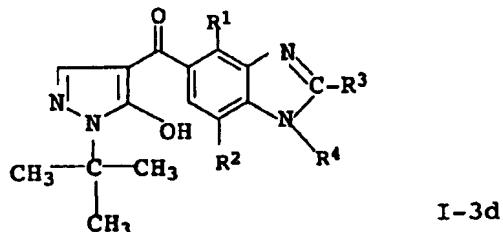
I-3c

114

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3c, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 43: Verbindungen I-3d.1 bis I-3d.1363

10



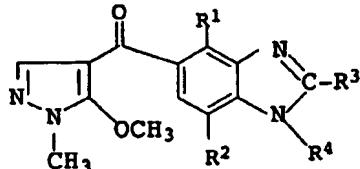
15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3d, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

20

Tabelle 44: Verbindungen I-3e.1 bis I-3e.1363

25



I-3e

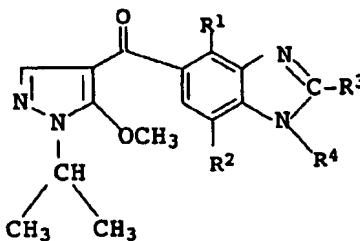
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3e, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35

Tabelle 45: Verbindungen I-3f.1 bis I-3f.1363

40



I-3f

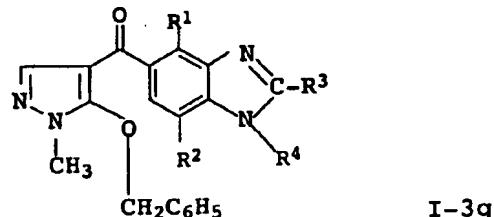
45

115

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3f, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 46: Verbindungen I-3g.1 bis I-3g.1363

10

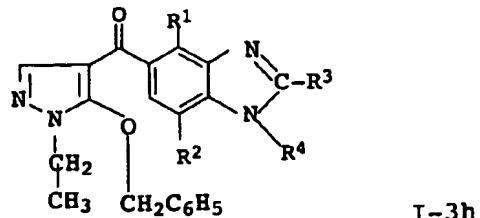


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3g, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

20 - Tabelle 47: Verbindungen I-3h.1 bis I-3h.1363

25

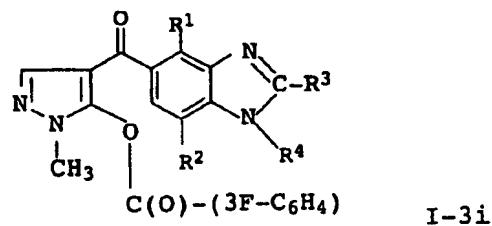


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3h, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 48: Verbindungen I-3i.1 bis I-3i.1363

40



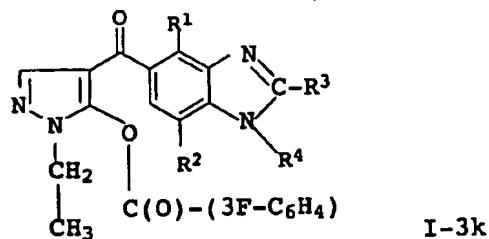
45

116

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3i, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 49: Verbindungen I-3k.1 bis I-3k.1363

10

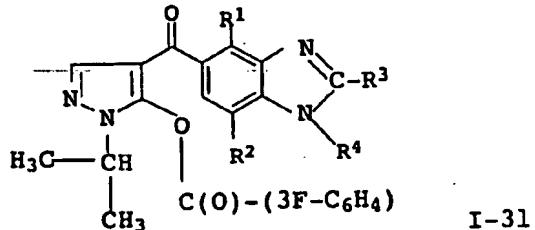


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3k, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

20 - Tabelle 50: Verbindungen I-3l.1 bis I-3l.1363

25

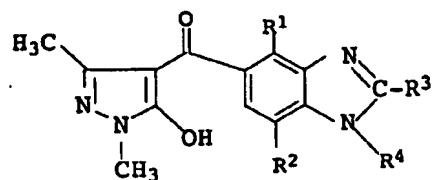


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3l, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 51: Verbindungen I-3m.1 bis I-3m.1363

40



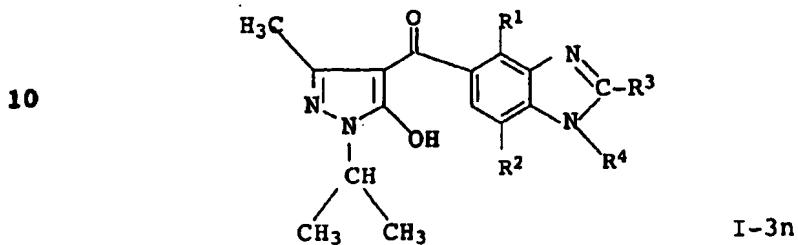
I-3m

45

117

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3m, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

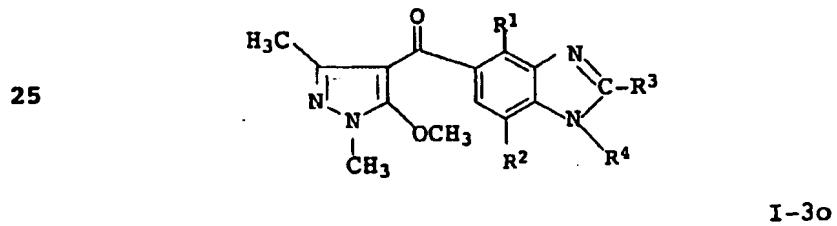
5 - Tabelle 52: Verbindungen I-3n.1 bis I-3n.1363



15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3n, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

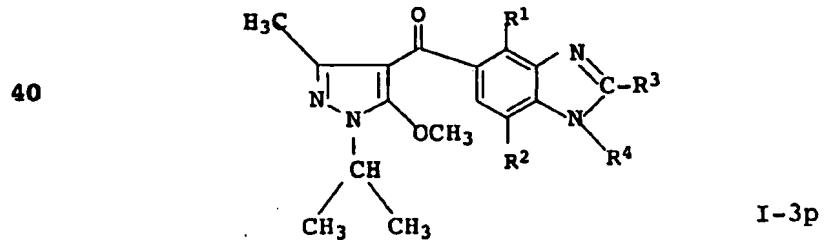
20 - Tabelle 53: Verbindungen I-3o.1 bis I-3o.1363



30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3p, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 54: Verbindungen I-3p.1 bis I-3p.1363



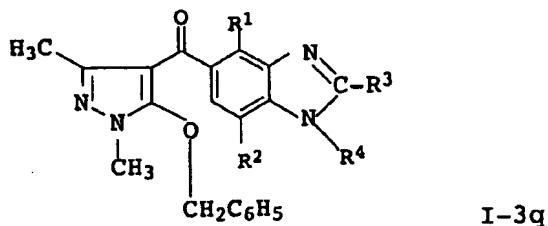
45

*118*

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3p, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

5 - Tabelle 55: Verbindungen I-3q.1 bis I-3q.1363

10

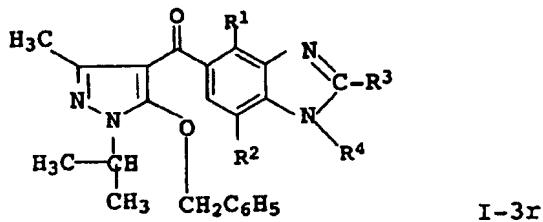


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3g, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

20 - Tabelle 56: Verbindungen I-3r.1 bis I-3r.1363

25

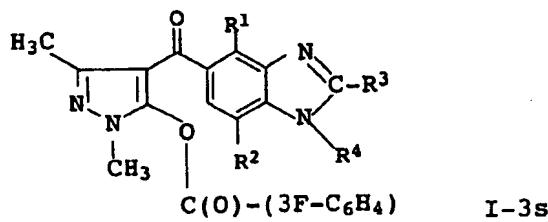


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3r, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 57: Verbindungen I-3s.1 bis I-3s.1363

40

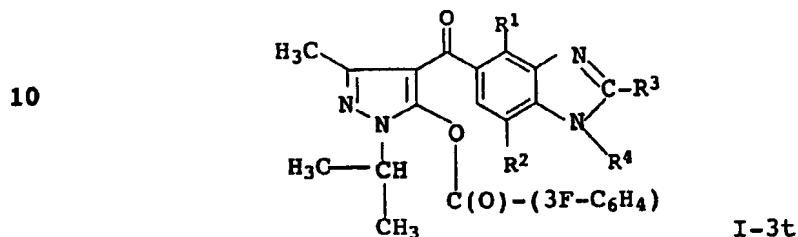


45

119

Verbindungen der allgemeinen Formel I-3s, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup> R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

## 5 - Tabelle 58: Verbindungen I-3t.1 bis I-3t.1363



15 Verbindungen der allgemeinen Formel I-3t, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup> und R<sup>4</sup> für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

## 20 Tabelle C

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y
1	H	H	N	S
2	CH <sub>3</sub>	H	N	S
25	Cl	H	N	S
4	OCH <sub>3</sub>	H	N	S
5	SCH <sub>3</sub>	H	N	S
6	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	S
30	H	Cl	N	S
7	CH <sub>3</sub>	Cl	N	S
8	Cl	Cl	N	S
10	OCH <sub>3</sub>	Cl	N	S
35	SCH <sub>3</sub>	Cl	N	S
12	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	N	S
13	H	CH <sub>3</sub>	N	S
14	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	S
40	Cl	CH <sub>3</sub>	N	S
16	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	S
17	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	S
18	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	S
19	H	H	N	NH
45	20	CH <sub>3</sub>	N	NH
21	Cl	H	N	NH

120

	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y
22	OCH <sub>3</sub>	H	N	NH
23	SCH <sub>3</sub>	H	N	NH
5 24	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	NH
25	H	Cl	N	NH
26	CH <sub>3</sub>	Cl	N	NH
27	Cl	Cl	N	NH
10 28	OCH <sub>3</sub>	Cl	N	NH
29	SCH <sub>3</sub>	Cl	N	NH
30	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	N	NH
31	H	CH <sub>3</sub>	N	NH
32	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NH
15 33	Cl	CH <sub>3</sub>	N	NH
34	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NH
35	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NH
36	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NH
20 37	H	H	N	NCH <sub>3</sub>
38	CH <sub>3</sub>	H	N	NCH <sub>3</sub>
39	Cl	H	N	NCH <sub>3</sub>
40	OCH <sub>3</sub>	H	N	NCH <sub>3</sub>
25 41	SCH <sub>3</sub>	H	N	NCH <sub>3</sub>
42	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	NCH <sub>3</sub>
43	H	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
44	CH <sub>3</sub>	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
45	Cl	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
30 46	OCH <sub>3</sub>	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
47	SCH <sub>3</sub>	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
48	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	N	NCH <sub>3</sub>
49	H	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
35 50	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
51	Cl	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
52	OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
53	SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
40 54	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NCH <sub>3</sub>
55	H	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
56	CH <sub>3</sub>	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
57	Cl	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
58	OCH <sub>3</sub>	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
45 59	SCH <sub>3</sub>	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
60	S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>

121

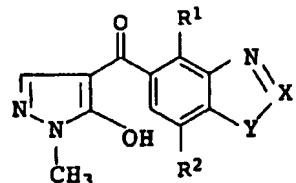
	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	X	Y
5	61 H	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	62 CH <sub>3</sub>	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	63 Cl	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	64 OCH <sub>3</sub>	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	65 SCH <sub>3</sub>	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	66 S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
10	67 H	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	68 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	69 Cl	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	70 OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	71 SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
	72 S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	NC <sub>2</sub> H <sub>5</sub>
15	73 H	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	74 CH <sub>3</sub>	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	75 Cl	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	76 OCH <sub>3</sub>	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	77 SCH <sub>3</sub>	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	78 S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
20	79 H	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	80 CH <sub>3</sub>	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	81 Cl	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	82 OCH <sub>3</sub>	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	83 SCH <sub>3</sub>	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	84 S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	Cl	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
25	85 H	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	86 CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	87 Cl	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	88 OCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	89 SCH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>
	90 S(O) <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	N	N-i-C <sub>3</sub> H <sub>7</sub>

122

Weitere Beispiele für erfindungsgemäße bevorzugte Benzthiadiazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Pyrazolen ( $X = N, Y = S$ ) und Benzotriazol-5-ylcarbonyl-Derivate von Pyrazolen ( $X = N, Y = N-R^4$ ) sind die in den Tabellen 59 bis 77 genannten Verbindungen (Verbindungen I-4).

- Tabelle 59: Verbindungen I-4a.1 bis I-4a.90

10



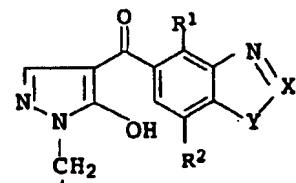
15

I-4a

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4a, in der die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  und  $Y$  für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 60: Verbindungen I-4b.1 bis I-4b.90

25



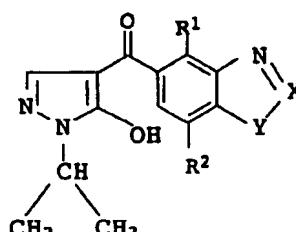
30

I-4b

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4b, in der die Substituenten  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $X$  und  $Y$  für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

- Tabelle 61: Verbindungen I-4c.1 bis I-4c.90

40



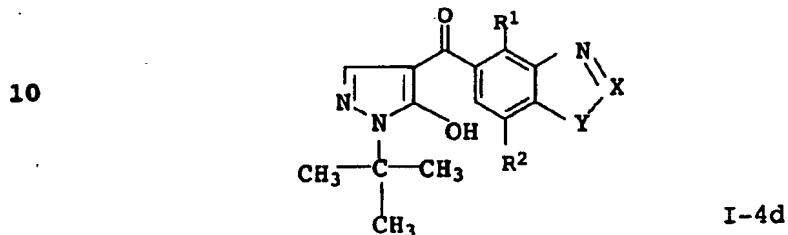
45

I-4c

123

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4c, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

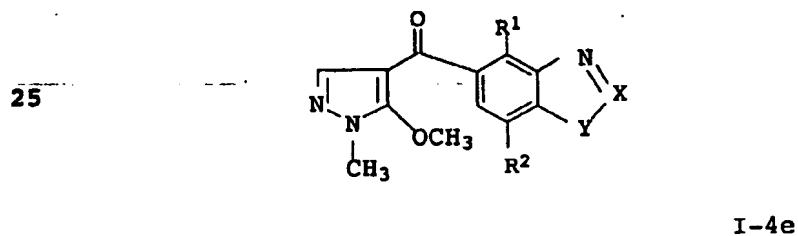
5 - Tabelle 62: Verbindungen I-3d.1 bis I-3d.1363



15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4d, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

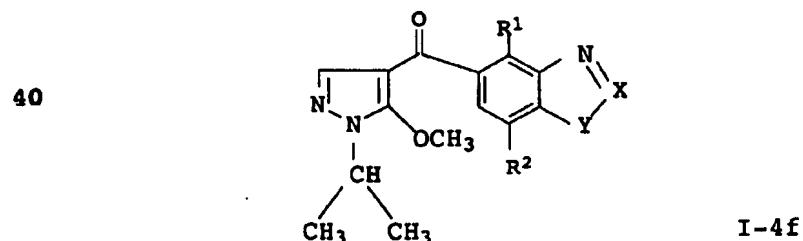
20 - Tabelle 63: Verbindungen I-4e.1 bis I-4e.90



30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4e, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

35 - Tabelle 64: Verbindungen I-4f.1 bis I-4f.90



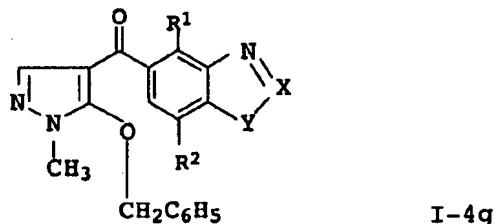
45

124

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4f, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 65: Verbindungen I-4g.1 bis I-4g.90

10



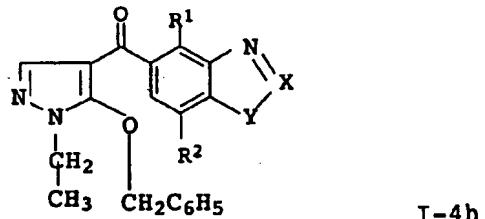
15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4g, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20

Tabelle 66: Verbindungen I-4h.1 bis I-4h.90

25



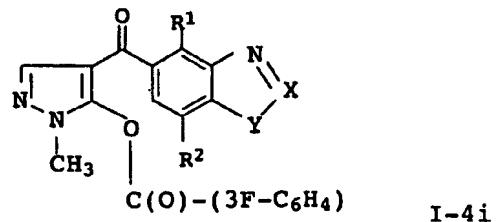
30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4h, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

35

Tabelle 67: Verbindungen I-4i.1 bis I-4i.90

40



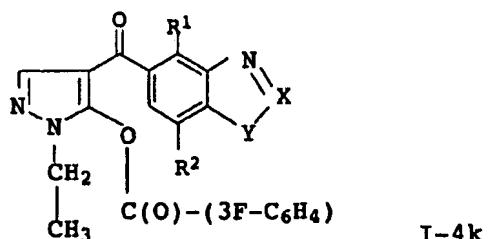
45

125

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4i, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 68: Verbindungen I-4k.1 bis I-4k.90

10

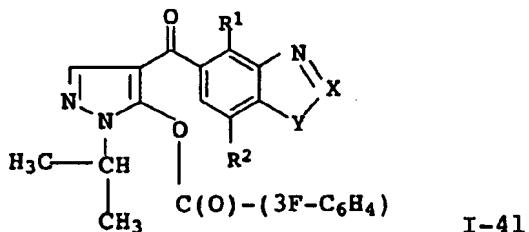


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4k, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20 - Tabelle 69: Verbindungen I-4l.1 bis I-4l.90

25

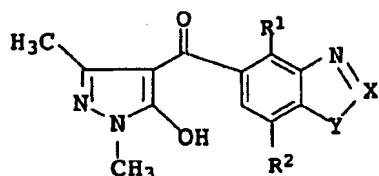


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4l, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

35 - Tabelle 70: Verbindungen I-4m.1 bis I-4m.90

40



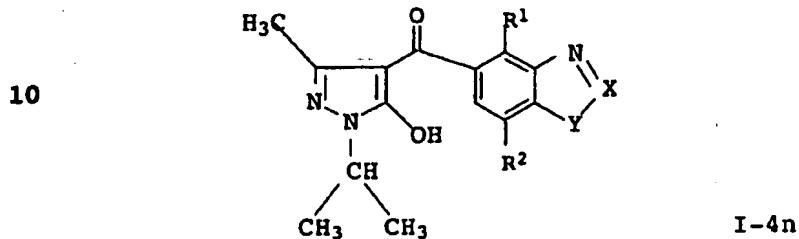
I-4m

45

126

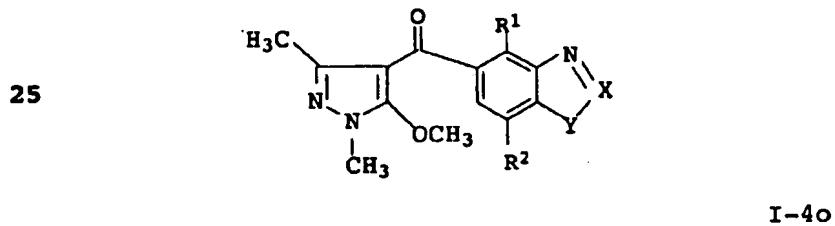
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4m, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 71: Verbindungen I-4n.1 bis I-4n.90



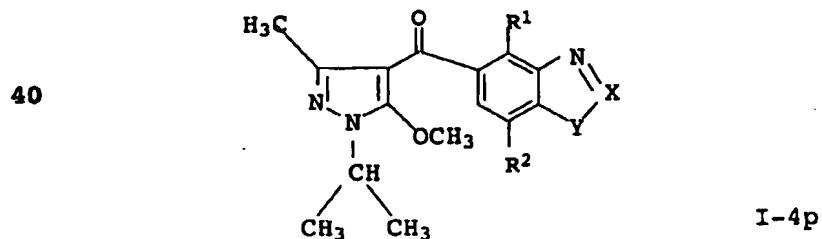
15  
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4n, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20 - Tabelle 72: Verbindungen I-4o.1 bis I-4o.90



30  
Verbindungen der allgemeinen Formel I-4o, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

35 - Tabelle 73: Verbindungen I-4p.1 bis I-4p.90



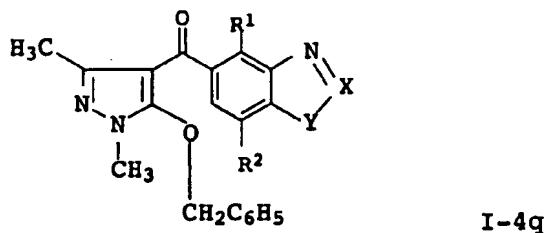
45

127

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4p, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 74: Verbindungen I-4q.1 bis I-4q.90

10

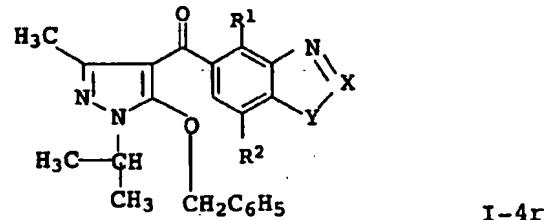


15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4q, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20 - Tabelle 75: Verbindungen I-4r.1 bis I-4r.90

25

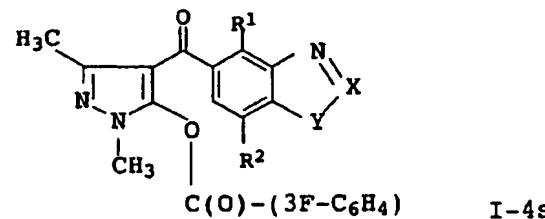


30

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4r, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle B entsprechen.

35 - Tabelle 76: Verbindungen I-4s.1 bis I-4s.90

40



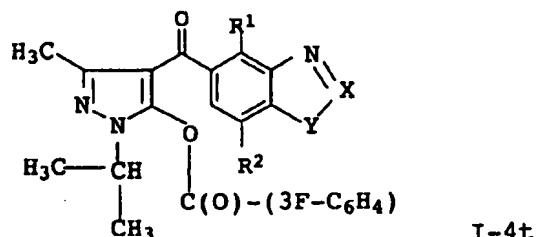
45

128

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4s, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

5 - Tabelle 77: Verbindungen I-4t.1 bis I-4t.90

10



15

Verbindungen der allgemeinen Formel I-4t, in der die Substituenten R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, X und Y für jede einzelne Verbindung jeweils einer Zeile der Tabelle C entsprechen.

20  
25

Die Darstellung von Verbindungen der Formel I, worin R<sup>8</sup> für Hydroxy steht, erfolgt durch Umsetzung einer aktivierten Carbonsäure IVb oder einer Carbonsäure IVa, die vorzugsweise in situ aktiviert wird, mit 5-Hydroxypyrazol der Formel III zu dem Acylierungsprodukt und anschließende Umlagerung.

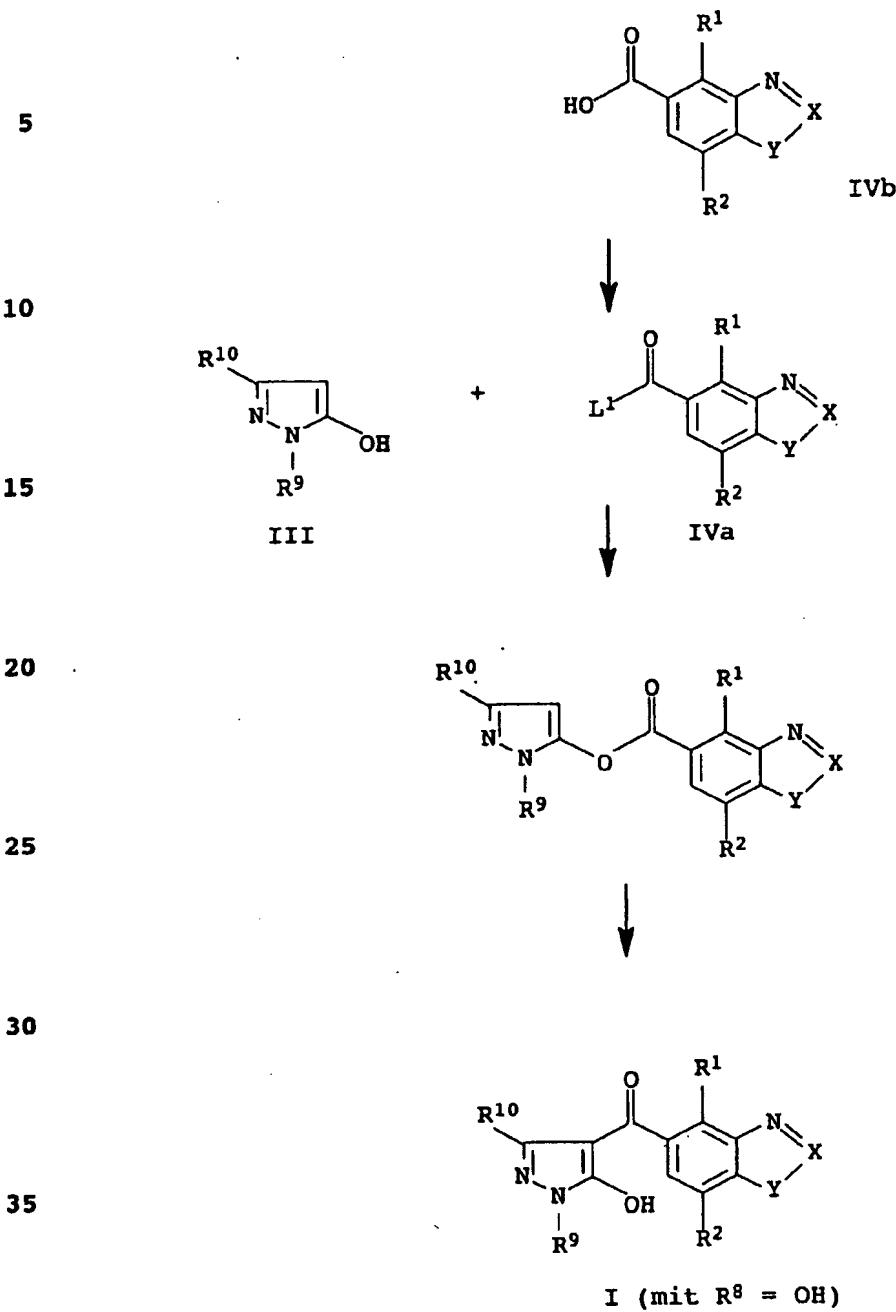
30

35

40

45

129



40

$L^1$  steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie Halogen z.B. Brom oder Chlor, Hetaryl, z.B. Imidazolyl oder Pyridyl, Carboxylat, z.B. Acetat oder Trifluoracetat etc.

45

## 130

Die aktivierte Carbonsäure IVa kann direkt eingesetzt werden, wie im Fall der Benzoylhalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. mit einem Carbodiimid wie Ethyl-(3'-dimethylaminopropyl)carbodiimid, Dicyclohexylcarbodiimid, Triphenylphosphin/Azodicarbonsäure-5 ester, 2-Pyridindisulfid/Triphenylphosphin, Carbonyldiimidazol etc.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Acylierungsreaktion in Gegenwart einer Base auszuführen. Die Reaktanden und die 10 Hilfsbase werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der Hilfsbase z.B. 1,2 bis 1,5 Moläquivalente, bezogen auf IVa bzw. IVb, kann unter Umständen vorteilhaft sein.

15 Als Hilfsbasen eignen sich tertiäre Alkylamine, Pyridin 4-Dimethylaminopyridin oder Alkalimetallcarbonate. Als Lösungsmittel können z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether, wie Diethylether, Methyl-20 tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid oder Ester wie Essigsäureethylester oder Gemische hier- von verwendet werden.

25 Werden Halogenide als aktivierte Carbonsäurekomponente eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe dieses Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0 bis 10°C abzukühlen. Anschließend röhrt man bei 20 bis 100°C, vorzugsweise bei 25 bis 30 50°C, bis die Umsetzung vollständig ist. Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Methylenchlorid, Diethylether und Essigsäure-ethylester. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittels kann der rohe Ester ohne weitere Reinigung zur 35 Lagerung eingesetzt werden.

Die Umlagerung der Ester zu den Verbindungen der Formel I erfolgt zweckmäßigerweise bei Temperaturen von 20 bis 100°C in einem Lösungsmittel und in Gegenwart einer Base sowie gegebenenfalls 40 mit Hilfe einer Cyanoverbindung als Katalysator.

Als Lösungsmittel können z.B. Acetonitril, Methylenchlorid, 1,2-Dichlorethan, Dioxan, Essigsäureethylester, Toluol oder Gemische hiervon verwendet werden. Bevorzugte Lösungsmittel sind 45 Acetonitril und Dioxan.

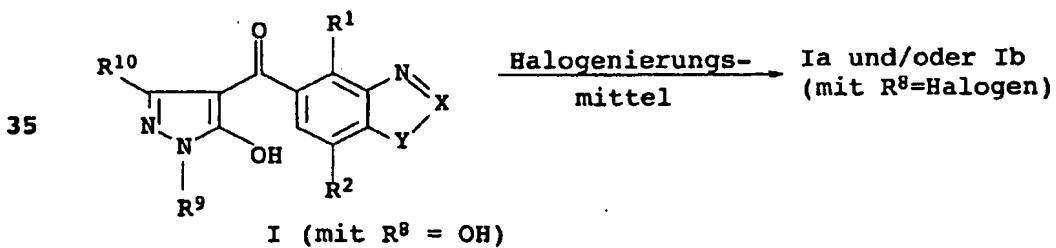
131

Geeignete Basen sind tertiäre Amine wie Triethylamin, aromatische Amine wie Pyridin oder Alkalicarbonate, wie Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat, die vorzugsweise in äquimolarer Menge oder bis zu einem vierfachen Überschuß, bezogen auf den Ester, eingesetzt werden. Bevorzugt werden Triethylamin oder Alkalicarbonat verwendet, vorzugsweise in doppelt äquimolaren Verhältnis in Bezug auf den Ester.

Als Cyanoverbindungen kommen anorganische Cyanide, wie Natriumcyanid oder Kaliumcyanid und organische Cyanoverbindungen, wie Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid in Betracht. Sie werden in einer Menge von 1 bis 50 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt. Vorzugsweise werden Acetoncyanhydrin oder Trimethylsilylcyanid, z.B. in einer Menge von 5 bis 15, vorzugsweise etwa 10 Molprozent, bezogen auf den Ester, eingesetzt.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise erfolgen. Das Reaktionsgemisch wird z.B. mit verdünnter Mineralsäure, wie 5 %ige Salzsäure oder Schwefelsäure, angesäuert, mit einem organischen Lösungsmittel, z.B. Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert. Der organische Extrakt kann mit 5-10%iger Alkalicarbonatlösung, z.B. Natriumcarbonat- oder Kaliumcarbonatlösung extrahiert werden. Die wäßrige Phase wird angesäuert und der sich bildende Niederschlag abgesaugt und/oder mit Methylenchlorid oder Essigsäureethylester extrahiert, getrocknet und eingengt.

B. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit R<sup>8</sup> = Halogen erfolgt durch Umsetzung von Pyrazol-Derivaten der Formel 30 I (mit R<sup>8</sup>=Hydroxy) mit Halogenierungsmitteln:

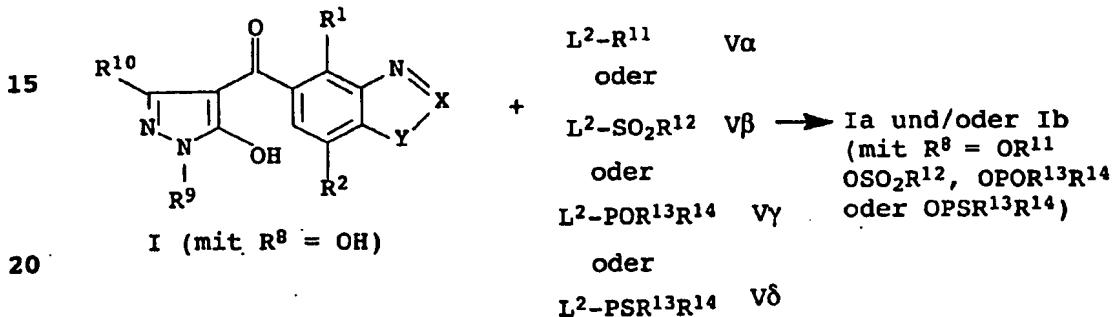


40 Hier und im folgenden steht "Verbindung 1a" für eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin Pz für einen Pyrazolylrest der allgemeinen Formel IIa steht und Verbindung 1b entsprechend für eine Verbindung der allgemeinen Formel I, worin Pz für einen Rest IIb steht.

## 132

Als Halogenierungsmittel eignen sich beispielsweise Phosgen, Diphosgen, Triphosgen, Thionylchlorid, Oxalylchlorid, Phosphoroxychlorid, Phosphorpentachlorid, Mesylchlorid, Chlormethylen-N,N-dimethylammoniumchlorid, Oxalylbromid, 5 Phosphoroxybromid etc.

- C. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = OR^{11}$ ,  
 $OSO_2R^{12}$ ,  $OPOR^{13}R^{14}$  oder  $OPSR^{13}R^{14}$  durch Umsetzung von Pyrazol-  
10 Derivaten der Formel I (mit  $R^8 = \text{Hydroxy}$ ) mit Alkylierungs-,  
Sulfonylierungs- bzw. Phosphorylierungsmitteln  $V\alpha$ ,  $V\beta$ ,  $V\gamma$  be-  
ziehungsweise  $V\delta$ .



25  $L^2$  steht für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe, wie  
Halogen, z.B. Chlor oder Brom, Hetaryl, z.B. Imidazolyl,  
Carboxylat, z.B. Acetat, oder Sulfonat, z.B. Mesylat oder  
Triflat etc.

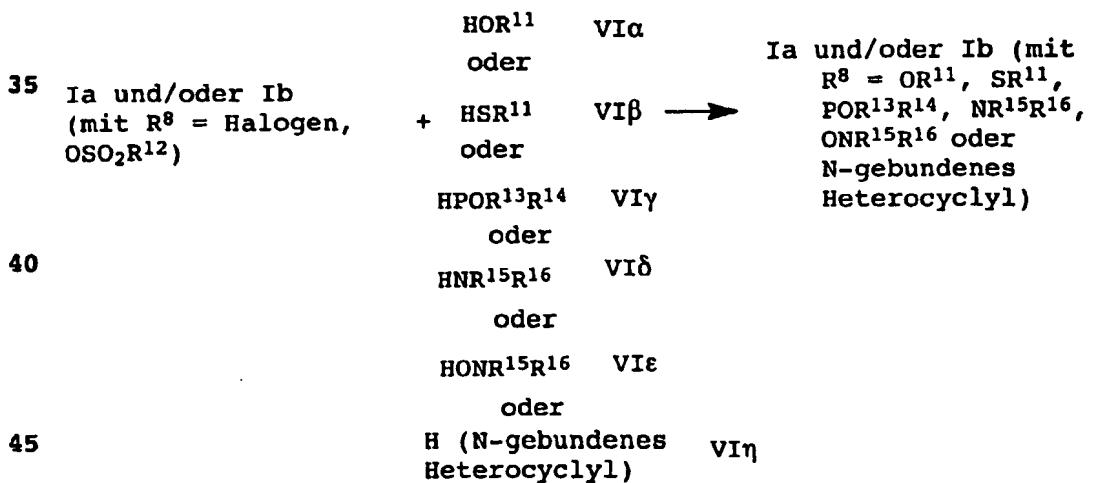
30 Bei der Herstellung von Verbindungen der Formel I mit  
 $R^8 = OR^{11}$  aus Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = OH$  arbeitet  
man vorzugsweise in Gegenwart einer Base.

35 Die Reaktanden und die Base werden dabei zweckmäßigerweise in  
äquimolaren Mengen eingesetzt. Ein geringer Überschuß der  
Base, z.B. 1,1 - 1,5 Moläquivalente, bezogen auf I kann unter  
Umständen vorteilhaft sein.

40 Als Basen eignen sich tertiäre Amine, Pyridine, Alkalimetallcarbonate oder Alkalimetallhydride. Als Lösungsmittel  
eignen sich z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasser-  
stoffe wie Toluol, Xylool oder Chlorbenzol, Ether wie Diethyl-  
ether, Methyl-tert-butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan oder  
Dimethoxyethan, polare aprotische Lösungsmittel wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid oder Ester wie  
45 Essigsäureethylester und Gemische hiervon.

## 133

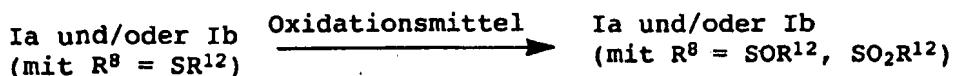
- Werden anstelle des Alkohols I ( $R^8 = OH$ ) Halogenide ( $R^8 = \text{Halogen}$ ) oder aktivierte Alkohole wie Mesylate oder Tosylate ( $R^8 = OSO_2CH_3$  oder  $OSO_2\text{-Tolyl}$ ) zur Derivatisierung eingesetzt, so kann es zweckmäßig sein, bei Zugabe des Reaktionspartners die Reaktionsmischung auf 0 bis 10°C abzukühlen. Anschließend röhrt man bei 20 bis 100°C, vorzugsweise bei 20 bis 75°C bis die Umsetzung vollständig ist.
- Die Aufarbeitung erfolgt in üblicher Weise, z.B. wird das Reaktionsgemisch auf Wasser gegossen, das Wertprodukt extrahiert. Als Lösungsmittel eignen sich hierfür besonders Lösungsmittel wie Methylenchlorid, Essigsäureethylester, Methyl-tert-butylether oder Diethylether. Nach Trocknen der organischen Phase und Entfernen des Lösungsmittel kann das Rohprodukt gegebenenfalls noch durch Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt werden. Als Eluenten eignen sich Lösungsmittel wie Methylenchlorid, Essigsäureethylester, Cyclohexan, Petrolether, Methanol, Aceton oder Chloroform und Gemische hiervon.
- Die Verbindungen der Formel Va, Vβ, Vy oder Vδ können direkt eingesetzt werden wie z.B. im Fall der Carbonsäurehalogenide oder in situ erzeugt werden, z.B. aktivierte Carbonsäuren (mit Carbonsäure und Dicyclohexylcarbodiimid etc.).
- D. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = OR^{11}$ ,  $SR^{11}$ ,  $POR^{13}R^{14}$ ,  $NR^{15}R^{16}$ ,  $ONR^{15}R^{16}$  oder N-gebundenes Heterocyclyl erfolgt durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = \text{Halogen}$ ,  $OSO_2R^{12}$  mit Verbindungen der Formel VIα, VIβ, VIγ, VIδ, VIε oder VIη, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base oder unter vorangehender Salzbildung.



134

- E. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = SOR^{12}$ ,  $SO_2R^{12}$  erfolgt beispielsweise durch Umsetzung von Verbindungen der Formel I mit  $R^8 = SR^{12}$  mit einem Oxidationsmittel.

5



10 Als Oxidationsmittel kommen beispielsweise m-Chlorperbenzösäure, Peroxyessigsäure, Trifluorperoxyessigsäure, Wasserstoffperoxid, ggf. in Gegenwart eines Katalysators wie Wolfram, in Betracht.

15 Für die unter den Punkten B bis E genannten Reaktionen gelten folgende Bedingungen:

Die Ausgangsverbindungen werden in der Regel im äquimolaren Verhältnis eingesetzt. Es kann aber auch von Vorteil sein, die 20 eine oder andere Komponente im Überschuß einzusetzen.

Gegebenenfalls kann es von Vorteil sein, die Umsetzungen in Gegenwart einer Base durchzuführen. Die Reaktanden und die Base werden dabei zweckmäßigerweise in äquimolaren Mengen eingesetzt.

25

Im Hinblick auf die Verfahren C und D kann es unter Umständen vorteilhaft sein, ein Überschuß der Base z.B. 1,5 bis 3 Moläquivalente jeweils bezogen auf das Edukt einzusetzen.

30 Als Basen eignen sich tertiäre Alkylamine, wie Triethylamin, aromatische Amine, wie Pyridin, Alkalimetallcarbonate, z.B. Natriumcarbonat oder Kaliumcarbonat, Alkalimetallhydrogencarbonate, wie Natriumhydrogencarbonat und Kaliumhydrogencarbonat, Alkalimetallalkoholate wie Natriummethanolat, Natriumethanolat, Kalium-tert.-butanolat oder Alkalimetallhydride, z.B. Natriumhydrid. Bevorzugt 35 verwendet werden Triethylamin oder Pyridin.

Als Lösungsmittel kommen z.B. chlorierte Kohlenwasserstoffe, wie Methylenchlorid oder 1,2-Dichlorethan, aromatische Kohlenwasser-40 stoffe, z.B. Toluol, Xylol oder Chlorbenzol, Ether, wie Diethyl-ether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, polare aprotische Lösungsmittel, wie Acetonitril, Dimethylformamid oder Dimethylsulfoxid oder Ester, wie Essigsäureethylester, oder Gemische hiervon in Betracht.

45

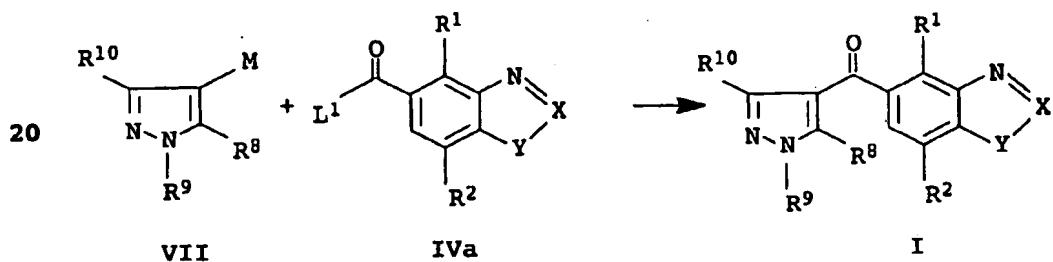
135

In der Regel liegt die Reaktionstemperatur im Bereich von 0°C bis zur Höhe des Siedepunktes des Reaktionsgemisches.

Die Aufarbeitung kann in an sich bekannter Weise zum Produkt hin erfolgen.

In Abhängigkeit von den Reaktionsbedingungen können bei den Verfahren B bis D die Verbindungen Ia, Ib oder Gemische hiervon gebildet werden. Letztere können durch klassische Trennmethoden, wie z.B. Kristallisation, Chromatographie etc., getrennt werden.

F. Die Darstellung von Verbindungen der Formel I, worin Pz für eine Gruppe der allgemeinen Formel IIa steht, kann auch durch Umsetzung eines metallierten Pyrazol-Derivats der Formel VII mit einem Carbonsäure-Derivat der Formel IVa erfolgen:



M steht hierbei für ein Metall, insbesondere für ein Alkalimetall wie Lithium oder Natrium, ein Erdalkalimetall wie z.B. Magnesium oder ein Übergangsmetall wie Palladium, Nickel etc. und L<sup>1</sup> für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe wie Halogen, z.B. Chlor oder Brom, Alkylsulfonat wie Mesylat, Halogenalkylsulfonat wie Triflat oder Cyanid. R<sup>8</sup> weist vorzugsweise keine aziden Wasserstoffatome auf.

Die Umsetzung wird in der Regel bei Temperaturen von -100°C bis Rückflußtemperatur des Reaktionsgemisches durchgeführt. Als Lösungsmittel eignen sich inerte aprotische Lösungsmittel, wie Ether, z.B. Diethylether, Tetrahydrofuran. Die Verbindungen der Formel IVa werden in der Regel im Überschuß eingesetzt, es kann aber auch von Vorteil sein, diese in äquimolaren Mengen oder im Unterschluß einzusetzen. Die Aufarbeitung erfolgt zum Produkt hin.

Die metallierten Pyrazol-Derivate der Formel VII können auf an sich bekannte Art und Weise durch Umsetzung von in 4-Position halogenierten Pyrazolen mit Metallen wie Lithium, Natrium, Magnesium etc. oder mit metallorganischen Verbindungen wie z.B. Butyllithium gebildet werden. Es ist aber auch möglich Pyrazole, die in 4-Position mit Wasserstoff verknüpft sind, direkt zu metallieren, z.B. mit den voranstehend genannten Metallen bzw. metall-

136

organischen Verbindungen. Die Umsetzungen werden in der Regel in einem inerten aprotischen Lösungsmittel durchgeführt, bevorzugt in Ether wie Diethylether, Tetrahydrofuran etc.. Die Reaktions-temperatur liegt im Bereich von -100°C bis zur Höhe des Siedepunk-  
tes des Reaktionsgemisches. Die Verbindungen der Formel VII wer-  
den vorzugsweise *in situ* erzeugt und direkt umgesetzt.

Die als Ausgangsmaterialien verwendeten 5-Hydroxypyrazole der  
Formel III sind bekannt oder können an sich nach bekannten Ver-  
fahren hergestellt werden, wie sie beispielsweise in der EP-A  
240 001, in J. Chem. Soc. 315, S.383 (1997), J. Prakt. Chem. 315,  
S. 382 (1973) beschrieben sind (siehe auch Übersichten in Advan-  
ces Heterocycle. Chem. 48, S. 223-299 (1990) und Katritzky, Rees  
(Hrsg.), Comprehensive Heterocyclic Chem. Vol. 5, Pergamon Press  
1984, Oxford, S. 167-343 und dort zitierte Literatur). 1,3-Dime-  
thyl-5-hydroxypyrazol ist überdies eine käufliche Verbindung.

Die Alkylierungsmittel Va, Sulfonylierungsmittel Vβ, Phosphonylie-  
rungsmittel Vγ beziehungsweise Vδ, sowie die Verbindungen VIα,  
VIβ, VIγ, VIδ und VIε sind ebenfalls bekannt oder können nach be-  
kannten Verfahren hergestellt werden.

Die Carbonsäuren der allgemeinen Formel IVa beziehungsweise ihre  
aktivierten Derivate IVb sind entweder aus der Literatur bekannt  
oder lassen sich in Analogie zu bekannten Verfahren herstellen.

In Schema 1 ist ein üblicher Zugang zu Benzothiazol-5-carbonsäu-  
ren (Verbindungen IV-1) dargestellt.

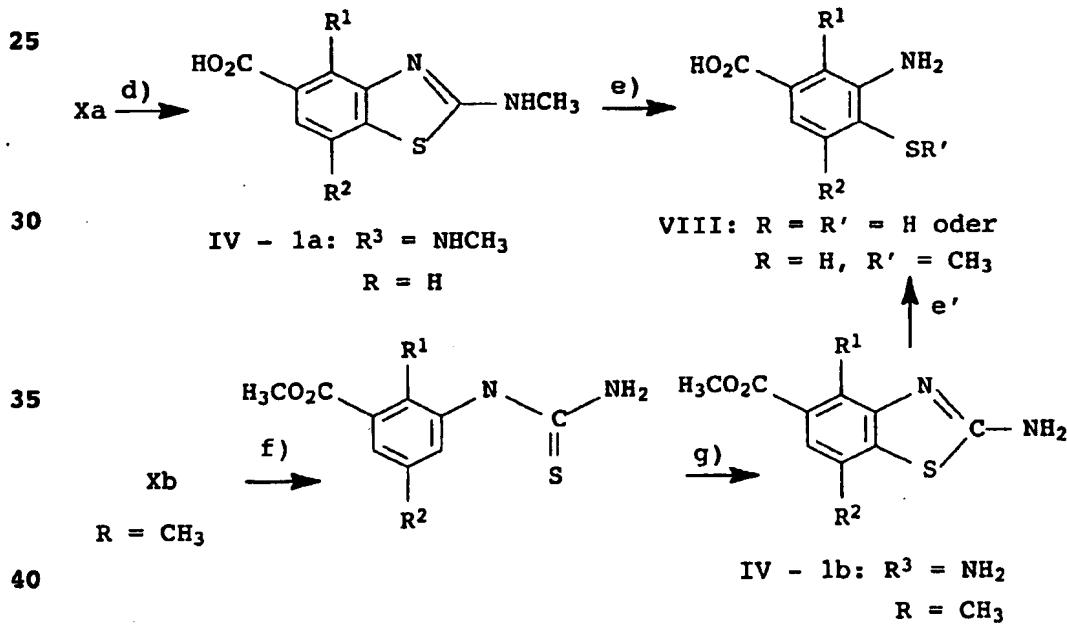
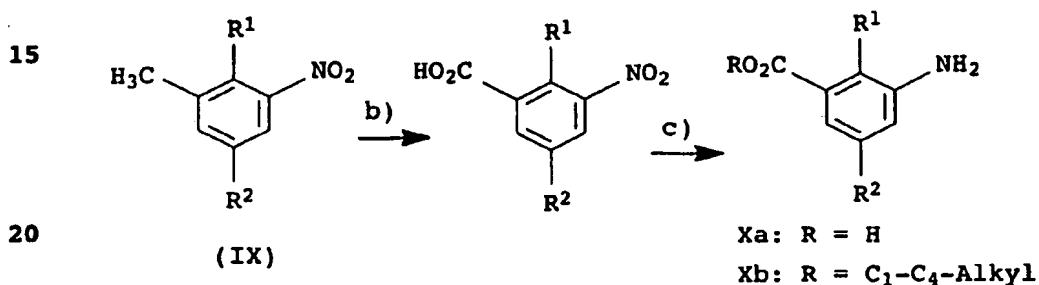
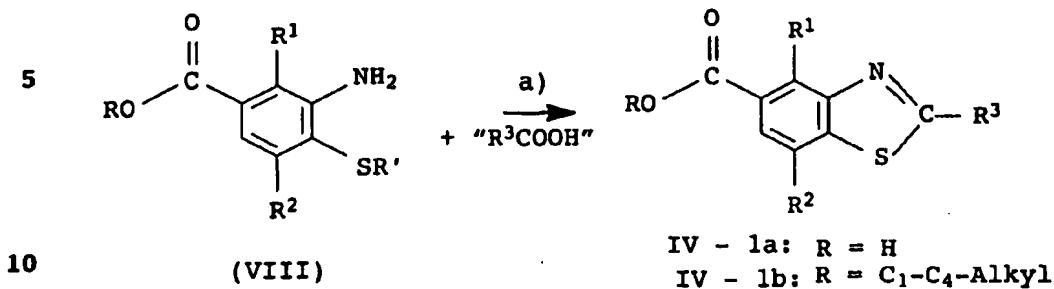
30

35

40

45

Schema 1



In der Formel IV-1 steht R für Wasserstoff (Verbindung IV-1a) oder einen verseifbaren Kohlenwasserstoffrest, z.B. für Methyl 45 (Verbindung IV-1b). Verbindungen der allgemeinen Formel IV-1 lassen sich beispielsweise gemäß Reaktionsschritt a) durch Kondensation von ortho-Aminothiophenolen der allgemeinen Formel VIII

138

(R' = H) oder von ortho-Aminothioethern der allgemeinen Formel VIII (R' = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, z.B. Methyl) mit einem Carbonsäureäquivalent "R<sup>3</sup>-CO<sub>2</sub>H" also einer Carbonsäure R<sup>3</sup>CO<sub>2</sub>H oder aktivierte Derivate R<sup>3</sup>COL<sup>1</sup>, R<sup>3</sup>C(L<sup>3</sup>)<sub>3</sub> davon, worin L<sup>1</sup> für eine reaktive Abgangsgruppe steht und L<sup>3</sup> für eine C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxygruppe steht, herstellen. Beispiele für L<sup>1</sup> sind Chlor, Brom, Carboxylat, wie Acetat, Trifluoracetat, N-Heterocyclen, wie Imidazolyl, Pyridyl etc. Beispiele für R<sup>3</sup>COL<sup>1</sup> und R<sup>3</sup>C(L<sup>3</sup>)<sub>3</sub> sind die Säurehalogenide, Carbonsäureester und Carbonsäureanhydride sowie die Orthoester der Carbonsäuren R<sup>3</sup>CO<sub>2</sub>H.

Die Kondensationsreaktion a) erfolgt vorzugsweise unter neutralen bis sauren Reaktionsbedingungen, vorzugsweise in Gegenwart einer anorganischen oder organischen Säure, wie beispielsweise Salzsäure, Schwefelsäure, p-Toluolsulfinsäure und Pyridinium-p-toluolsulfonat in einem organischen Lösungsmittel bei Temperaturen im Bereich von 0 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 20 bis 120°C. Als Lösungsmittel kommen insbesondere gesättigte Kohlenwasserstoffe, halogenierte Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol, aliphatische Ether wie Diethylether und tert-Butyl-methylether oder Pyridin in Betracht. Zur Herstellung von Benzothiazolen aus o-Aminothiophenolen beziehungsweise entsprechenden Thiomethylethern siehe auch Houben-Weyl, Methoden der Organischen Chemie, Bd. E 8b, S.869-871.

25

Schritt a) kann auch zweistufig durchgeführt werden, wobei zunächst die Aminofunktion in VIII mit einer Carbonsäure R<sup>9</sup>-COOH oder einem Derivat davon zum Carbonsäureamid umgesetzt wird, das anschließend zum Benzothiazol der allgemeinen Formel IV-1 cyclisiert wird.

Die Umsetzung zum Amid gelingt unter den für die Amidbildung üblichen Bedingungen, beispielsweise durch Umsetzung einer Säure in Gegenwart eines wasserbindenden Mittels. Die Cyclisierung gelingt mit Lewissäuren oder Phosgen. Die Cyclisierung wird dann vorzugsweise in einem inerten organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem aliphatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoff oder in einem Halogenkohlenwasserstoff durchgeführt.

40 Ortho-Aminothiophenole der allgemeinen Formel VIII (R' = H) können gemäß Schema 1 ausgehend von 3-Nitrotoluolen der allgemeinen Formel IX hergestellt werden. Hierin kann die Methylgruppe in bekannter Weise katalytisch oder stöchiometrisch zur Carbonsäure oxidiert werden (Schritt b). Als Oxidationsmittel können beispielsweise Metalloxide von Übergangsmetallen, beispielsweise Mangandioxid, Chromtrioxid sowie deren anionische Komplexsalze, z.B. Natriumdichromat oder Chromylchlorid, Pyridiniumchromat,

139

weiterhin oxidierende Säuren, beispielsweise  $\text{HNO}_3$ , oxidierende Gase wie Sauerstoff oder Chlor, gegebenenfalls in Anwesenheit von Übergangsmetallen (beziehungsweise der Salze, z.B. der Oxide oder Chloride) als Katalysatoren eingesetzt werden. Je nach Löslichkeit der zu oxidierenden Verbindung und abhängig von dem Verwendeten Oxidationsmittel arbeitet man vorzugsweise in wässrigen Lösungen, einphasigen Systemen aus Wasser und mit Wasser mischbaren organischen Lösungsmitteln oder in mehrphasigen Systemen aus Wasser- und organischen Lösungsmitteln unter Phasentransferkatalyse.

10 Abhängig vom gewählten Oxidationsmittel wird man die Oxidation in der Regel bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 100°C durchführen. Zur Oxidation von aromatischen Methylgruppen zu Benzoesäuren siehe beispielsweise (Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie", V. Band, 15 IV/1a 1981; Bd. VIII 1952; E. Bengtsson, Acta Chem. Scand. 1953, 7, 774; Singer et al. Org. Synth. Coll. Vol III, 1955, 740; B.A.S. Hay et al. Can. J. Chem. 1965, 43, 1306)

Die so erhaltenen 3-Nitro-benzoesäurederivate werden anschließend 20 in Schritt c) zu den 3-Aminobenzoesäuren reduziert. Die selektive Reduktion von aromatischen Nitrogruppen in Anwesenheit von Carbonsäuregruppen ist grundsätzlich bekannt. Als Reduktionsmittel kommen beispielsweise Hydrazine, Metallhydride wie Aluminiumhydrid, und davon abgeleitete Komplexverbindungen wie Lithiumaluminiumhydrid, Disobutylaluminiumhydrid, oder Borane in Betracht. Bevorzugtes Reduktionsmittel ist Wasserstoff in Gegenwart von katalytischen Mengen an Übergangsmetallen beispielsweise Ni, Pd, Pt, Ru oder Rh, die in geträgerter Form, beispielsweise auf Aktivkohle, in Form aktivierter Metalle, z.B. Raney-Nickel, oder in 30 Form löslicher Komplexverbindungen eingesetzt werden können. Geeignete Lösungsmittel für die Reduktion sind abhängig von der Löslichkeit des zu hydrierenden Substrates und dem gewählten Reduktionsmittel C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkohole, wie Methanol, Ethanol, n-Propanol, Isopropanol oder n-Butanol, halogenierte C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Kohlenwasserstoffe, 35 wie Dichlormethan, Trichlormethan, Trichlorethan, Trichlorethylen, aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol, Xylole, Chlorbenzol, wässrige Lösungen anorganischer oder organischer Säuren, wie wässrige Salzsäure. Üblicherweise erfolgt die Reduktion bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +100°C, vorzugsweise 40 im Bereich von 0 bis 40°C. Die Reduktion mit Wasserstoff erfolgt üblicherweise bei einem Wasserstoffdruck im Bereich von 1 bis 50 bar, vorzugsweise im Bereich von 1 bis 10 bar. Zur katalytischen Hydrierung aromatischer Nitrogruppen siehe beispielsweise Rylander in "Catalytic Hydrogenation over Platinum Metals", Academic 45 Press, New York, 1967, 168-202; Furst et al., Chem. Rev. 1965, 65, 52; Tepko et al., J. Org. Chem. 1980, 45, 4992.

140

Die so erhaltenen o-Aminobenzoësäuren der allgemeinen Formel Xa (R = H) werden dann in einem weiteren Reaktionsschritt d) mit einem organischen Isothiocyanat (in Schema 1 Methylisothiocyanat) zu einem substituierten Thioharnstoffderivat umgesetzt, das ohne 5 weitere Isolierung oxidativ zur Benzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IX-1a (in Schema 1 mit R<sup>3</sup> = NH-CH<sub>3</sub>) cyclisiert wird.

Der erste Reaktionsschritt in Stufe d), nämlich die Umsetzung der 10 m-Aminobenzoësäure der allgemeinen Formel Xa zum substituierten Harnstoff erfolgt durch Umsetzung mit einem C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylisothiocyanat oder einem gegebenenfalls substituierten Phenylisothiocyanat in einem wasserfreien, organischen Lösungsmittel bei Temperaturen im Bereich von -15°C bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 15 -15°C bis 100°C. Geeignete Lösungsmittel sind beispielsweise aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, wie n-Hexan oder Cyclohexan, halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Dichlormethan, Trichlormethan, Trichlorethan, Trichlorethylen, aromatische Kohlenwasserstoffe wie Benzol oder Anisol, Dialkylether oder cyclische Ether wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, wasserfreie Carbonsäuren wie Eisessig oder in Pyridin. Zur Herstellung substituierter Thioharnstoffe siehe beispielsweise: Kurzer, F., Org. Synth. 1951, 31, 21; R.R. Gupta et al., Synth. Commun. 17(2), 229-240 (1987); Rathke, Ber. Dtsch. 20 Chem. Ges. 1885, 18, 3102; Schiff, Justus Liebigs Ann. Chem., 1868, 148, 338; Frank, R.L., Smith, P.V.; Org. Synth. 1955, III, 735, N.B. Ambati et al., Synth. Commun. 1997, 27 (9), 1487-1493; W.O. Foye, J. Pharm.. Sci., 1977, 66, No. 7, 923-926.

25 Das so erhaltene, substituierte Thioharnstoff-Derivat wird dann in einem zweitem Reaktionsschritt von Schritt d) mit einem halogenhaltigen Oxidationsmittel wie Brom, Sulfurylchlorid oder Chlor in einem inerten organischen Lösungsmittel zur substituierten 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1a 30 (in Schema 1 steht R<sup>3</sup> für NH-CH<sub>3</sub>) cyclisiert. Die Cyclisierung erfolgt in der Regel bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 120°C. Geeignete Lösungsmittel sind insbesondere die vorgenannten aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoffe, die vorgenannten aromatischen 35 Kohlenwasserstoffe, die vorgenannten wasserfreien Carbonsäuren, ferner C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkanole, z.B. Methanol, Ethanol oder Isopropanol, Dialkylether, cyclische Ether und Mischungen der vorgenannten Lösungsmittel. Zur oxidativen Cyclisierung substituierter Thioharnstoffe zu Benzothiazolen siehe beispielsweise Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie V, Bd.E8B, 1994, S.865 f.

40

45

141

Die substituierte 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1a kann entweder direkt mit einem Hydroxypyrazol der allgemeinen Formel III oder einem aktivierten Derivat davon in der oben beschriebenen Weise zur erfindungsgemäßen Verbindung 5 I (mit Y = S und X = C-NH-R'', wobei R'' für C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl oder gegebenenfalls substituiertes Phenyl steht) umgesetzt werden.

Sofern R<sup>3</sup> in Formel IV-1a für NH-CH<sub>3</sub> steht, können durch Hydrolyse gemäß Schritt e) auch die o-Aminothiobenzoësäuren der allgemeinen 10 Formel VIII (mit R = R' = H) hergestellt werden. Der Hydrolyse folgt in der Regel noch die Methylierung zum Methylthioether VIII (R = H, R' = CH<sub>3</sub>). Die Hydrolyse in Schritt e) erfolgt beispielsweise durch Umsetzung der Verbindung IV-1a (mit R<sup>3</sup> = NH-CH<sub>3</sub>) mit einem Alkalihydroxid, z.B. Lithium-, Natrium- oder Kaliumhydroxid, einem Erdalkalihydroxid oder Alkaliiodiden, wie Natriumiodid 15 in einem geeigneten Lösungsmittel bei erhöhter Temperatur, wobei vorzugsweise in Abwesenheit von Sauerstoff gearbeitet wird. Übliche Reaktionstemperaturen liegen im Bereich von 0 bis 200°C, insbesondere im Bereich von 20 bis 180°C. Geeignete Lösungsmittel 20 sind neben den vorgenannten aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoffen, den halogenierten Kohlenwasserstoffen, den aromatischen Kohlenwasserstoffen, den vorgenannten Ethern und Alkoholen insbesondere wässrige, einphasige Systeme und Pyridin. Zur Verseifung der substituierten 2-Aminobenzothiazol-5-carbon- 25 säuren siehe beispielsweise: Organikum, 16. Aufl. 1986, S. 415; Mc Murry, Org. React. 1976, 24, 187; Taschner et al., Rocz. Chem. 1956, 30, 323; z.B. Houben-Weyl: "Methoden der organischen Chemie", Band E8b, 1994; S.1010 f.; J. Chem. Soc. Perkin Trans., Part 1, 1976, No. 12, 1291-1296, insbesondere A.R. Katritzky et 30 al., J. Heterocycl. Chem. 30 (1) 135-139, 1993. Die Umsetzung zum Methylthioether VIII mit R = H und R' = CH<sub>3</sub> gelingt in einfacher Weise durch Umsetzung mit Methyliodid oder Dimethylsulfat.

In ähnlicher Weise können Verbindungen der allgemeinen Formel 35 VIII mit R = H erhalten werden, wenn man zunächst die 3-Aminobenzoësäure der allgemeinen Formel Xa mit einem C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkanol, z.B. mit Methanol in bekannter Weise verestert. Der so erhaltene Ester der allgemeinen Formel Xb (R = C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, insbesondere Methyl) wird dann in Schritt f) mit Isothiocyanäure oder einem geeigneten Salz der Isothiocyanäure, z.B. Natriumrhodanid in Gegenwart einer konzentrierten Mineralsäure, zum Thioharnstoff-Derivat umgesetzt. Die Reaktionsbedingungen entsprechen dem unter Schritt d) für die Harnstoffderivate angegebenen Reaktionsbedingungen. Das Thioharnstoffderivat wird anschließend in Schritt g) unter 45 den oben genannten Bedingungen zum 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäureester der allgemeinen Formel IV-1b (R<sup>3</sup> = NH<sub>2</sub>) cyclisiert. Die so erhaltene Verbindung der allgemeinen Formel IV-1b mit R<sup>3</sup> = NH<sub>2</sub>

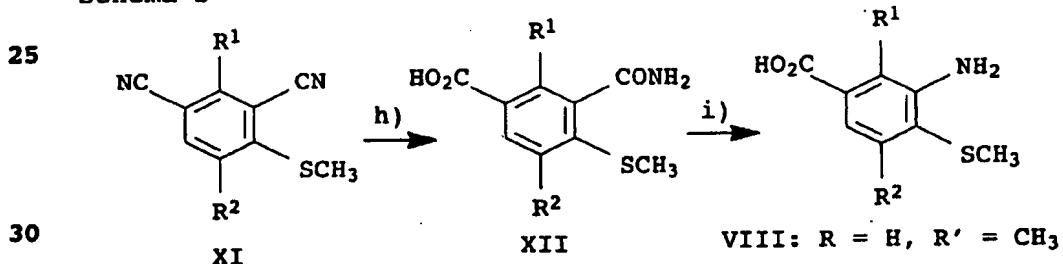
142

kann entweder in Schritt e' zur Verbindung VIII hydrolysiert und gegebenenfalls anschließend methyliert werden (VIII: R = H, R' = CH<sub>3</sub>) werden.

5 Sie kann auch in der oben beschriebenen Weise zur erfundungsgemäßen Verbindung I (mit X = C-NH<sub>2</sub> und Y = S) umgesetzt werden. Zudem besteht die Möglichkeit, die 2-Aminogruppe der Verbindung IV-1b zunächst zu diazotieren und auf diesem Wege weitere Funktionalitäten in die 2-Position des Benzothiazolgerüstes einzuführen. Die  
 10 Umwandlung von R<sup>3</sup> = NH<sub>2</sub> in R<sup>3</sup> = Halogen gelingt in bekannter Weise unter Sandmeyer-Bedingungen. Die Umwandlung von R<sup>3</sup> = NH<sub>2</sub> in R<sup>3</sup> = H gelingt in bekannter Weise durch sukzessive Umsetzung des 2-Aminobenzothiazol-5-carbonsäureesters mit Nitrit unter sauren Bedingungen und anschließend einem Reduktionsmittel wie Hypophosphoriger Säure, Natriumborhydrid, Trialkylsilane, Trialkylstannane, SnCl<sub>2</sub>, NO, Wilkinsonkatalysatoren; siehe auch J. Am. Chem. Soc. 1949, 71, S.2137; J. Am. Chem. Soc. 1950, 72, S.3013; 1954, Bd.76, S.290.

20 Ein weiterer Zugang zu Verbindungen der allgemeinen Formel VIII wird in Schema 2 aufgezeigt.

Schema 2



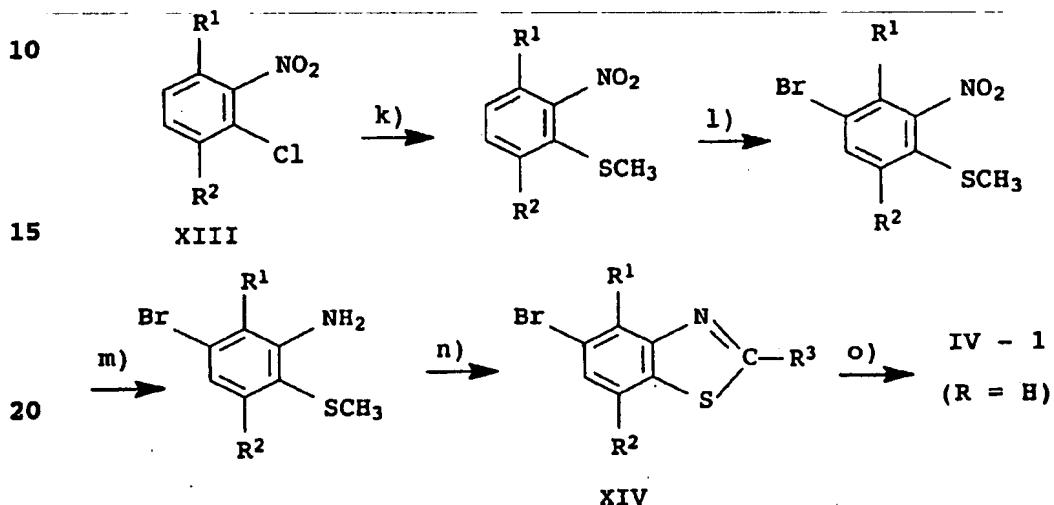
Ausgehend von 2,4-Dicyanothioanisolen der allgemeinen Formel XI wird durch selektive Hydrolyse im Schritt h) das Amid der allgemeinen Formel XII hergestellt. Aufgrund der unterschiedlichen 35 Reaktivität der beiden Methylgruppen gelingt die Darstellung unter üblichen, alkalischen Verseifungsbedingungen, wobei man vorentscheidend das Fortschreiten der Reaktion kontrolliert. Verfahren zur alkalischen Verseifung von Nitrilen sind beispielsweise aus Org. Synth. Coll. Vol. 1, 1941, S.321 bekannt. In einem weiteren 40 Schritt i) wird dann die Amidfunktion in den Verbindungen der allgemeinen Formel XII im Sinne eines Hofmann-Abbaus in eine Aminofunktion umgewandelt. Hierbei werden Verbindungen der allgemeinen Formel VIII mit R=H und R'=CH<sub>3</sub> erhalten. Typische Bedingungen für den Hofmann-Abbau sind: wässrig alkalische Chlor- oder Hy- 45 pochloridlösungen, Temperaturen im Bereich von 0 bis 150°C und

143

vorzugsweise im Bereich von 20 bis 120°C (siehe auch Organikum 16.  
Auflage 1986, S. 572).

Ein weiterer Zugang zu Benzothiazol-5-carbonsäuren wird in  
5 Schema 3 gezeigt. Dieser Zugang macht von der Umwandlung von Ben-  
zothiazolen der allgemeinen Formel XIV in entsprechende Carbon-  
säuren gemäß Reaktionsschritt o) Gebrauch.

Schema 3



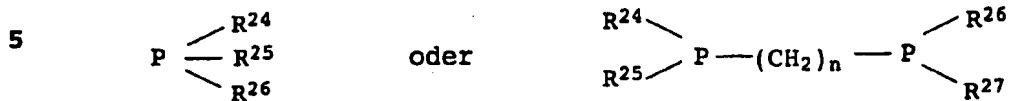
Die Umwandlung des Brombenzothiazols der allgemeinen Formel XIV  
25 in die Carbonsäure der allgemeinen Formel IV-1 (R=H) gelingt bei-  
spielsweise durch sukzessive Umsetzung von XIV mit Magnesium zur  
entsprechenden Grignard-Verbindung und anschließender Umsetzung  
der Grignard-Verbindung mit Kohlendioxid. Alternativ kann die  
Verbindung XIV durch Halogen-Metallaustausch mit einem Alkalime-  
30 tallalkyl, z.B. einem Lithiumalkyl, wie Methyllithium, n-Butylli-  
thium oder tert-Butyllithium, und anschließende Umsetzung des Re-  
aktionsproduktes mit CO<sub>2</sub> in die Verbindung IV-1 überführt werden.

Reaktionsschritt o) in Schema 3 kann auch durch Umsetzung des  
35 5-Brombenzothiazols der allgemeinen Formel XIV mit Kohlenmonoxid,  
einer Base und Wasser unter erhöhtem Druck in Gegenwart eines  
Pd-, Ni-, Co- oder Rh-Katalysators realisiert werden.

Die Katalysatoren Nickel, Cobalt, Rhodium und insbesondere  
40 Palladium können metallisch oder in Form üblicher Salze wie in  
Form von Halogenverbindungen, z.B. PdCl<sub>2</sub>, RhCl<sub>3</sub>·H<sub>2</sub>O, Acetaten,  
z.B. Pd(OAc)<sub>2</sub>, Cyaniden usw. in den bekannten Wertigkeitsstufen  
vorliegen. Ferner können Metallkomplexe mit tertiären Phosphinen,  
Metallalkylcarbonyle, Metallcarbonyle, z.B. CO<sub>2</sub>(CO)<sub>8</sub>, Ni(CO)<sub>4</sub>,  
45 Metallcarbonyl-Komplexe mit tertiären Phosphinen, z.B.  
(PPh<sub>3</sub>)<sub>2</sub>Ni(CO)<sub>2</sub>, oder mit tertiären Phosphinen komplexierte Über-  
gangsmetallsalze vorliegen. Die letztgenannte Ausführungsform ist

144

insbesondere im Fall von Palladium als Katalysator bevorzugt. Dabei ist die Art der Phosphinliganden breit variabel. Beispielsweise lassen sie sich durch folgende Formeln wiedergeben:



wobei n die Zahlen 1, 2, 3 oder 4 bedeutet und die Reste R<sup>24</sup> bis R<sup>26</sup> für niedermolekulares Alkyl, z.B. C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, Aryl,  
10 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylaryl, z.B. Benzyl, Phenethyl oder Aryloxy stehen.  
Aryl ist z.B. Naphthyl, Anthryl und vorzugsweise gegebenenfalls  
substituiertes Phenyl, wobei man hinsichtlich der Substituenten  
nur auf deren Inertheit gegenüber der Carboxylierungsreaktion  
zu achten hat, ansonsten können sie breit variiert werden und  
15 umfassen alle inerten C-organischen Reste wie C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylreste,  
z.B. Methyl, Carboxylreste wie COOH, COOM (M ist z.B. ein  
Alkali-, Erdalkalimetall oder Ammoniumsalz), oder C-organische  
Reste über Sauerstoff gebunden wie C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyreste.

20 Die Herstellung der Phosphinkomplexe kann in an sich bekannter Weise, z.B. wie in den eingangs genannten Dokumenten beschrieben, erfolgen. Beispielsweise geht man von üblichen kommerziell erwerblichen Metallsalzen wie  $\text{PdCl}_2$  oder  $\text{Pd}(\text{OCOCH}_3)_2$  aus und fügt das Phosphen z.B.  $\text{P}(\text{C}_6\text{H}_5)_3$ ,  $\text{P}(\text{n-C}_4\text{H}_9)_3$ ,  $\text{PCH}_3(\text{C}_6\text{H}_5)_2$ ,  
25 1,2-Bis(diphenylphosphino)ethan hinzu.

Die Menge an Phosphin, bezogen auf das Übergangsmetall, beträgt üblicherweise 0 bis 20, insbesondere 0,1 bis 10 Moläquivalente, besonders bevorzugt 1 bis 5 Moläquivalente.

**30** Die Menge an Übergangsmetall ist nicht kritisch. Natürlich wird man aus Kostengründen eher eine geringe Menge, z.B. von 0,1 bis 10 Mol.-%, insbesondere 1 bis 5 Mol.-%, bezogen auf den Ausgangsstoff IV.

**35** Zur Herstellung der Benzothiazol-5-carbonsäuren IV-1 ( $R = OH$ ) führt man die Umsetzung mit Kohlenmonoxid und mindestens äquimolaren Mengen an Wasser, bezogen auf die Ausgangsstoffe XIV durch. Der Reaktionspartner Wasser kann gleichzeitig auch als **40** Lösungsmittel dienen, d.h. die maximale Menge ist nicht kritisch.

Es kann aber auch je nach Art der Ausgangsstoffe und der verwendeten Katalysatoren von Vorteil sein, anstelle des Reaktionspartners ein anderes inertes Lösungsmittel oder die für die Carboxylierung verwendete Base als Lösungsmittel zu verwenden.

145

Als inerte Lösungsmittel kommen für Carboxylierungsreaktionen übliche Lösungsmittel wie Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylool, Hexan, Pentan, Cyclohexan, Ether z.B. Methyl-tert.butylether, Tetrahydrofuran, Dioxan, Dimethoxyethan, substituierte Amide 5 wie Dimethylformamid, persubstituierte Harnstoffe wie Tetra-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkylharnstoffe oder Nitrile wie Benzonitril oder Acetonitril in Betracht.

In einer bevorzugten Ausführungsform des Verfahrens verwendet man 10 einen der Reaktionspartner, insbesondere die Base, im Überschuß, so daß kein zusätzliches Lösungsmittel erforderlich ist.

Für das Verfahren geeignete Basen sind alle inerten Basen, die den bei der Umsetzung freiwerdenden Jodwasserstoff bzw. Bromwasserstoff zu binden vermögen. Beispielsweise sind hier tertiäre 15 Amine wie tert.-Alkylamine, z.B. Trialkylamine wie Triethylamin, cyclische Amine wie N-Methylpiperidin oder N,N'-Dimethyl-piperazin, Pyridin, Alkali- oder -hydrogencarbonate, oder tetra-alkylsubstituierte Harnstoffderivate wie Tetra-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl-20 harnstoff, z.B. Tetramethylharnstoff, zu nennen.

Die Menge an Base ist nicht kritisch, üblicherweise werden 1 bis 10, insbesondere 1 bis 5 Mol verwendet. Bei gleichzeitiger Verwendung der Base als Lösungsmittel, wird die Menge in der Regel 25 so bemessen, daß die Reaktionspartner gelöst sind, wobei man aus Praktikabilitätsgründen unnötig hohe Überschüsse vermeidet, um Kosten zu sparen, kleine Reaktionsgefäße einsetzen zu können und den Reaktionspartnern maximalen Kontakt zu gewährleisten.

30 Während der Umsetzung wird der Kohlenmonoxiddruck so eingestellt, daß immer ein Überschuß an CO, bezogen auf XIV vorliegt. Vorzugsweise liegt der Kohlenmonoxiddruck bei Raumtemperatur bei 1 bis 250 bar, insbesondere 5 bis 150 bar CO.

35 Die Carbonylierung wird in der Regel bei Temperaturen von 20 bis 250°C, insbesondere bei 30 bis 150°C kontinuierlich oder diskontinuierlich durchgeführt. Bei diskontinuierlichem Betrieb wird zweckmäßigerweise zur Aufrechterhaltung eines konstanten Druckes kontinuierlich Kohlenmonoxid auf das Umsetzungsgemisch aufge-40 preßt.

Die als Ausgangsverbindungen benutzten 5-Brombenzothiazole XIV sind bekannt oder können leicht durch geeignete Kombination bekannter Synthesen sowie nach der in Schema 3 beschriebenen Reaktionenfolge hergestellt werden.

146

Gemäß Schema 3 kann man beispielsweise o-Chlornitrobenzole der allgemeinen Formel XIII mit Alkalosalzen von Alkylmercaptanen in die entsprechenden o-Nitrothioether umwandeln (Schritt k). Der so erhaltene Thioether kann selektiv in der 3-Position zur Nitro-  
5 gruppe bromiert werden (Schritt l). Übliche Bromierungsreagenzien sind für diesen Zweck neben Brom - gegebenenfalls in Kombination mit einer Lewis-Säure wie  $\text{FeBr}_3$ , auch N-Bromsuccinimid, N-Bromhydantoin und Pyridiniumperbromid. Die Bromierung erfolgt vorzugsweise in einem organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem  
10 aliphatischen oder cycloaliphatischen Kohlenwasserstoff, Halogenkohlenwasserstoff oder wasserfreien organischen Säuren bei Temperaturen im Bereich von -15 bis 150°C, vorzugsweise im Bereich von -15 bis 100°C (siehe z.B. Organikum, 16. Aufl., 1986, S. 315). Anschließend wird in Schritt m) die Nitrogruppe zur Aminogruppe re-  
15 duziert. Die Bedingungen für Schritt m) entsprechen den für Schritt c) in Schema 1 angegebenen Bedingungen. Anschließend wird der o-Aminothioether aus Schritt m) in Schritt n) zum 5-Brombenzothiazol XIV cyclisiert. Die hierfür erforderlichen Reaktionsbedingungen entsprechen den für Schritt a) in Schema 1 angegebenen  
20 Bedingungen.

Zur Herstellung der Benzothiazol-S-dioxid-Verbindungen der allgemeinen Formel I ( $\text{Y} = \text{SO}_2$ ) werden beispielsweise die Benzothiazol-5-carbonsäuren IV-1a oder IV-1b oder die 5-Brombenzothia-  
25 zol-5-carbonsäuren XIV mit einem Oxidationsmittel umgesetzt, wo-  
bei das entsprechende S-Dioxid erhalten wird, das dann weiter wie beschrieben zur Zielverbindung der Formel I mit  $\text{Y} = \text{SO}_2$  weiterverarbeitet wird. Bevorzugt wird jedoch zunächst der Thiomethylether der allgemeinen Formel VIII (Schema 1, Formel VIII mit  $\text{R} = \text{H}$  und  
30  $\text{R}' = \text{CH}_3$ ) zum S-Dioxid VIIIC oxidiert und anschließend zur Benzothiazol-S-dioxid-5-carbonsäure der Formel IV-1c cyclisiert.

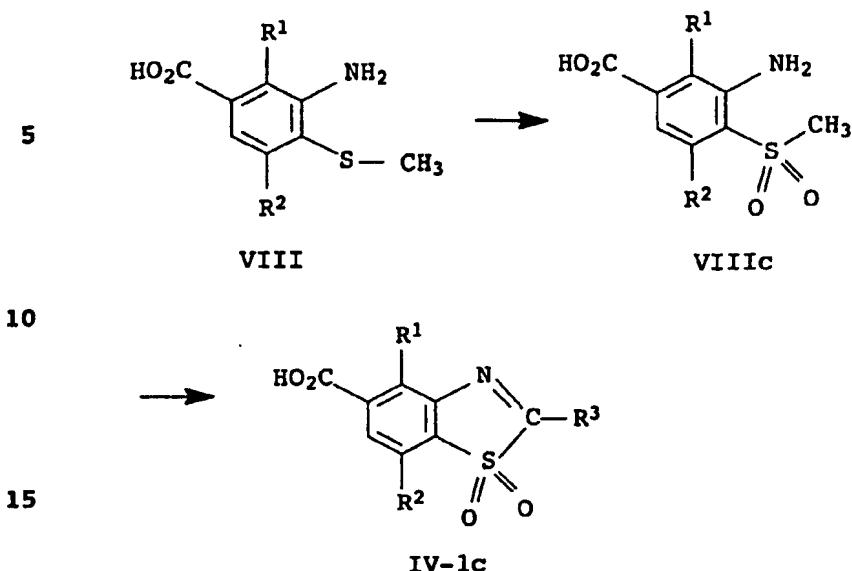
35

40

45

147

Schema 1a



Die Oxidation von VIII zum S-Dioxid gelingt mit Oxidationsmitteln wie Peroxysäuren, z.B. m-Chlorperbenzosäure, Peroxyessigsäure, Trifluorperoxyessigsäure oder mit Wasserstoffperoxid, das vorgezugsweise zusammen mit einem Übergangsmetall-Katalysator, z.B. Natriumwolframat(VI), eingesetzt wird. Die Cyclisierung von o-Methylsulfonylaminobenzolen der Formel VIIIC gelingt in Anlehnung an die in Chem. Heterocycl. Comp. Bd.3, 1967, S.197 ff beschriebene Methode.

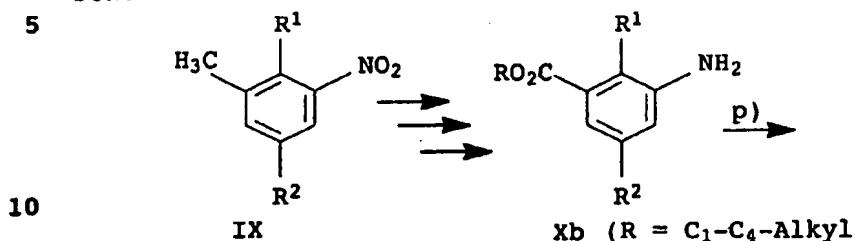
Eine Synthese für Benzoxazol-5-carbonsäurederivate der allgemeinen Formel IV-2 ( $\text{X} = \text{C}-\text{R}^3$ ,  $\text{Y} = \text{O}$ ) wird in Schema 4 beschrieben. Hierbei wird zunächst ausgehend von 3-Nitrotoluolen der allgemeinen Formel IX in der für Schema 1 beschriebenen Weise ein 3-Aminobenzoesäureester der allgemeinen Formel Xb ( $\text{R} = \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ ) hergestellt. In Schritt p) wird zunächst die Aminogruppe in Xb in bekannter Weise diazotiert und anschließend mit Alkaliaziden zu den entsprechenden 3-Azidobenzoesäuren der allgemeinen Formel XV umgesetzt. Das Azid XV wird anschließend in Reaktionsschritt q) mit einer Alkancarbonsäure, die gegebenenfalls auch halogeniert sein kann, z.B. Ameisensäure, Essigsäure, Trifluoressigsäure oder Propionsäure zum Benzoxazol-5-carbonsäureester der allgemeinen Formel IV-2a ( $\text{R}^3: \text{C}_1\text{-C}_4\text{-Alkyl}$ ) umgesetzt. Die Verbindung IV-2a kann entweder direkt zum erfindungsgemäßen Pyrazolylderivat der allgemeinen Formel I mit  $\text{X} = \text{CR}^3$  und  $\text{Y} = \text{O}$  umgesetzt werden oder alternativ in Reaktionsschritt r) zum o-Aminophenol der allgemeinen Formel XVI hydrolysiert werden. Die Verbindungen XVI können dann ähnlich wie die o-Aminothiophenole der allgemeinen Formel

148

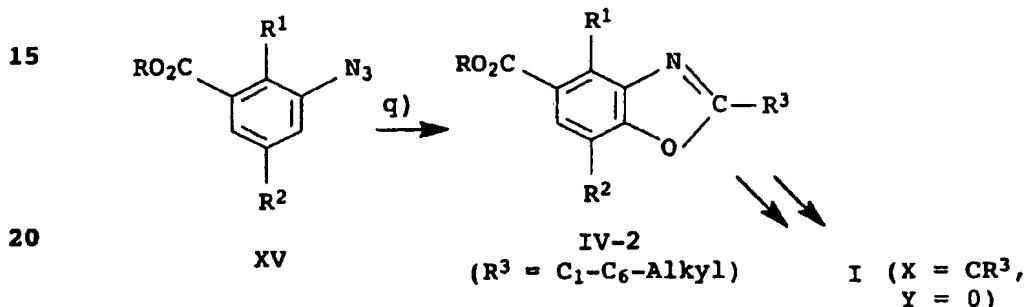
VIII zu den Benzoxazol-5-carbonsäureestern der allgemeinen Formel IV-2 umgesetzt werden.

Schema 4

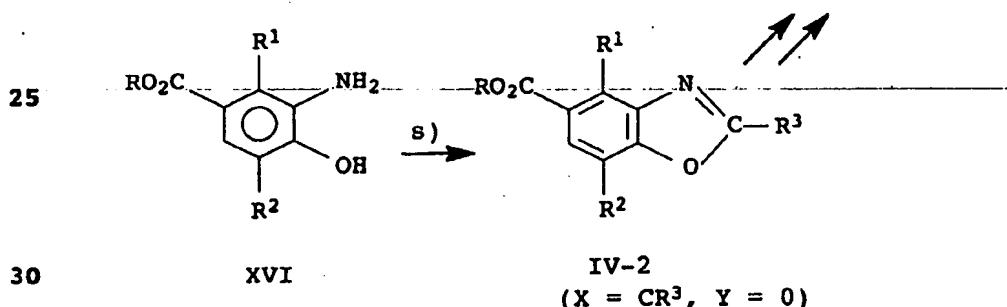
5



15



25



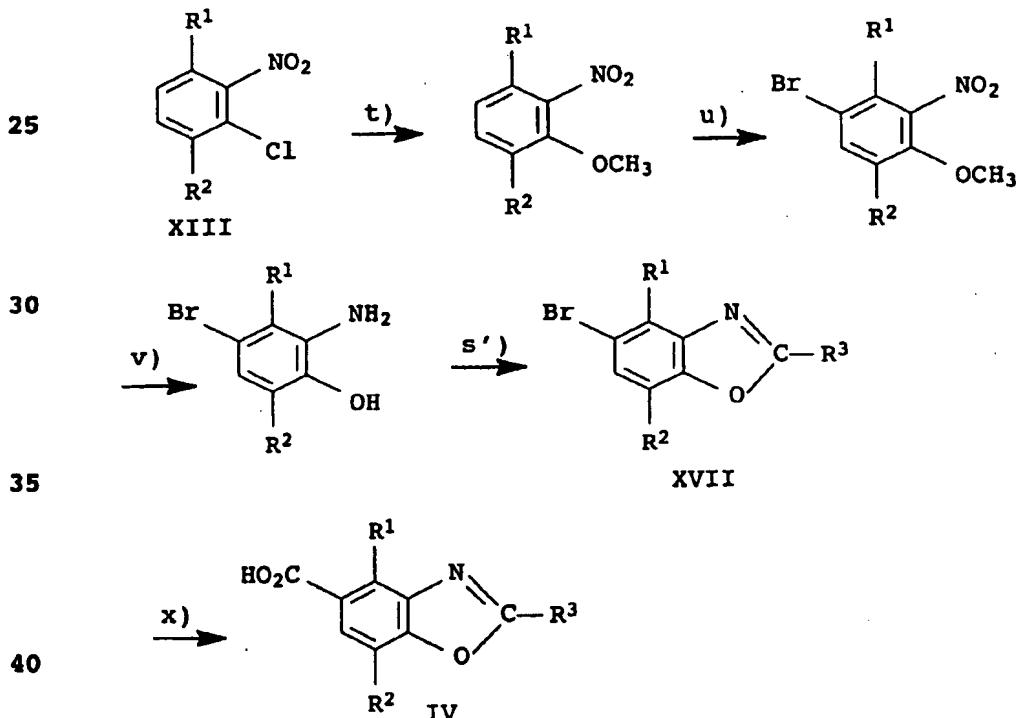
In Reaktionsschritt p) wird zunächst aus dem Amin der allgemeinen Formel Xb in wässriger saurer Lösung oder in einer wasserfreien Säure wie z.B. Ameisensäure, Essigsäure oder Trifluoressigsäure mit einem anorganischen Nitrit wie Natriumnitrit oder einem organischen Nitrit wie Isoamylnitrit eine aromatische Diazoniumverbindung hergestellt. Diese wird durch Zugabe eines Alkaliazids, beispielsweise Natriumazid zu der Lösung oder Suspension der Diazoniumverbindung umgesetzt, wobei man den 3-Azidobenzoesäureester gemäß Schema 4 erhält. Die Reaktionstemperatur der Umsetzung liegt in der Regel im Bereich von -15 bis +50°C, vorzugsweise im Bereich von 0 bis 20°C. Siehe auch K. G. Pinney et al., J. Org. Chem. [JOCEAH] 1991, 56 (9), 3125-3133.

149

Reaktionsschritt q) wird vorzugsweise in der zur Kondensation gewünschten wasserfreien Säure HOOC-R<sup>3</sup> in einem aromatischen Kohlenwasserstoff, wie Benzol, Toluol, Xylool oder Chlorbenzol durchgeführt. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel im Bereich von 50 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 50 bis 145°C. (Siehe hierzu auch B. Decroix et al., Bull. Soc. Chim. Fr. 1976, 621; S. Chaudhury et al., Can. J. Chem. 1982, 60, 1122). Die Verseifung des in Schritt q) erhaltenen Benzoxazol-5-carbonsäureesters zum 3-Amino-4-hydroxybenzoësäureester der allgemeinen Formel XVI erfolgt beispielsweise unter den für Reaktionsschritt e) in Schema 1 angegebenen Bedingungen. Die Kondensation von Verbindung XVI zum Benzoxazol-5-carbonsäureester in Schritt s) erfolgt beispielsweise unter den für Schritt a) in Schema 1 angegebenen Reaktionsbedingungen. (Siehe zu Schritt s) auch Houben-Weyl "Methoden der organischen Chemie, Bd.E8a, 1993, S.1020 f.)

Ein anderer Zugang zu Benzoxazol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel IV (X = C-R<sup>3</sup>, Y = O) ist in Schema 5 angegeben.

**20 Schema 5**



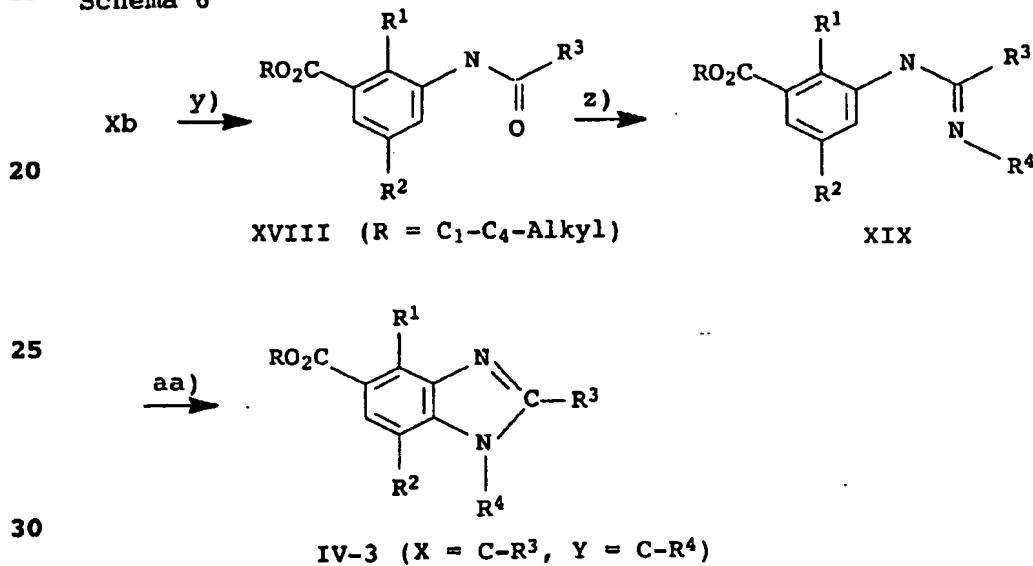
Hierbei wird zunächst ein o-Chlornitrobenzol der allgemeinen Formel XIII durch nukleophilen Austausch von Halogen gegen Methoxy in ein o-Nitroanisol überführt (Schritt t)). Dieses wird dann unter den für Schritt l) in Schema 3 angegebenen Reaktionsbedingun-

150

gen bromiert, wobei das Bromatom selektiv in die p-Position zur Methoxygruppe tritt. Das bromierte Nitroanisol wird dann zunächst selektiv zur Aminoverbindung reduziert und anschließend die Hydroxyfunktion durch Etherspaltung freigesetzt. Hierbei erhält man 2-Amino-4-bromphenole. Diese werden dann unter den für Schritt s) angegebenen Reaktionsbedingungen zum 5-Brombenzoxazol der allgemeinen Formel XVII cyclisiert. Die Verbindung XVII wird dann unter den für Schritt o) in Schema 3 beschriebenen Reaktionsbedingungen zu der Benzoxazol-5-carbonsäure der allgemeinen Formel IV (X = C-R<sup>3</sup> und Y = O) umgesetzt.

Ein Verfahren zur Herstellung von Benzimidazol-5-carbonsäureestern ist in Schema 6 angegeben.

15 Schema 6



Hierbei geht man zunächst wieder von 3-Nitrotoluolen aus, die in der zuvor beschriebenen Weise in 3-Aminobenzoesäureester der allgemeinen Formel Xb überführt werden. Die Verbindungen Xb werden dann in Reaktionsschritt y) mit einer Carbonsäure der allgemeinen Formel R<sup>3</sup>-CO<sub>2</sub>H oder einem reaktiven Carbonsäureäquivalent RCOL<sup>1</sup>, worin L<sup>1</sup> die zuvor genannte Bedeutung hat, zu einem Carbonsäureamid der allgemeinen Formel XVIII umgesetzt. Hierin hat R<sup>3</sup> eine der zuvor angegebenen Bedeutungen. XVIII wird dann unter sauren Bedingungen, z.B. mit Phosgen oder Phosphorylchlorid, in ein Nitriumion überführt, das mit einem Amin der allgemeinen Formel R<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub> oder mit Ammoniak abgefangen wird, wobei ein Iminoamid der Formel XIX entsteht. Die Verbindung XIX kann dann unter oxidierenden Bedingungen, wie beispielsweise für Reaktionsschritt b) oder g) in Schema 1 beschrieben, zum Benzimidazol-5-carbonsäure-

151

ster umgesetzt werden, der seinerseits zur Carbonsäure verseift werden kann.

Schritt y) wird in der Regel unter den für die Bildung von Amiden aus Carbonsäuren oder Carbonsäurederivaten und aromatischen Aminen üblichen Reaktionsbedingungen hergestellt. Die Reaktionstemperatur liegt in der Regel im Bereich von -15 bis 200°C, vorzugsweise im Bereich von 20 bis 150°C.

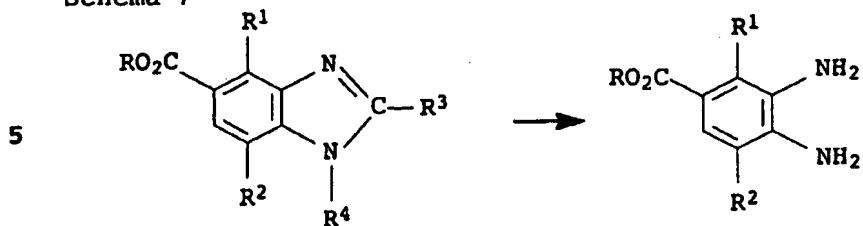
- 10 Zur Herstellung des Iminoamids der allgemeinen Formel XIX wird zunächst das Amid der allgemeinen Formel XVIII unter Wasserausschluß in einem organischen Lösungsmittel, beispielsweise einem der vorgenannten cycloaliphatischen oder aromatischen Kohlenwasserstoffe oder einem Ether gelöst und mit einer anorganischen  
 15 Säure, beispielsweise Salzsäure oder Schwefelsäure, einer Lewis-Säure wie Titanetetrachlorid oder einem Säurechlorid wie Sulfonylchlorid, Sulfurylchlorid, Phosphorylchlorid oder Phosgen in das Nitriliumion überführt. Die hierfür erforderlichen Temperaturen liegen in der Regel im Bereich von -15 bis 150°C und vorzugsweise im Bereich von 20 bis 140°C. Das Nitriliumion wird dann mit Ammoniak oder einem Amin der allgemeinen Formel R<sup>4</sup>-NH<sub>2</sub> abgefangen.

Die Cyclisierung der Verbindung XIX zum Benzimidazol-5-carbonsäureester der allgemeinen Formel IV (X = C-R<sup>3</sup>, Y = C-R<sup>4</sup>) wird in der  
 25 Regel mittels eines Oxidationsmittels wie Bleitetraacetat, Thallium(III)nitrit, Sulfurylchlorid oder Natriumhypochlorid unter wasserfreien Bedingungen durchgeführt. Als Lösungsmittel dienen beispielsweise aliphatische oder cycloaliphatische Kohlenwasserstoffe, aromatische Kohlenwasserstoffe oder Ether. Die Umsetzung  
 30 erfolgt in der Regel bei Temperaturen im Bereich -15 bis +150°C und vorzugsweise im Bereich von 0 bis 140°C. Zur Herstellung von Benzimidazolen aus Iminoamiden siehe auch (Can. J. Chem. 1982,  
 60, S.1122).

- 35 Die Herstellung von Benzoisothiodiazolen der allgemeinen Formel IV-4 (X-Y = S=N) gelingt beispielsweise ausgehend von Benzimidazol-5-carbonsäuren oder ihren Estern in der in Schema 7 beschriebenen Weise.

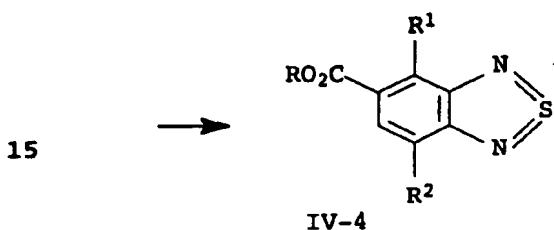
152

### Schema 7



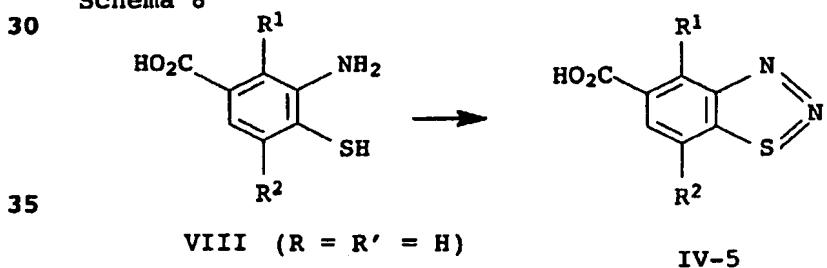
**IV-3** ( $X = C - R^3$ ,  $Y = C - R^4$ )

10 R = H oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl



Hierbei wird zunächst ein Benzimidazol-carbonsäureester oder die  
20 freie Carbonsäure zu 3,4-Diaminobenzoësäure verseift. Diese wird  
anschließend mit schwefliger Säure oder ihren Derivaten, z.B.  $\text{SO}_2$   
oder  $\text{SO}_2\text{Cl}_2$ , zur Benzoisothiadiazol-5-carbonsäure der allgemeinen  
Formel IV-4 cyclisiert. Üblicherweise wird die Cyclisierung bei  
Temperaturen im Bereich von 0 bis 200°C und vorzugsweise im Be-  
reich von 50 bis 150°C, z.B. in einem Lösungsmittel oder in der  
25 Schmelze, durchgeführt (siehe auch: Chem. Ber. 1967, Bd.100,  
S. 2164).

### Schema 8



40

45

153

Benzothiadiazol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel IV-5 ( $X = N, Y = S$ ) können ausgehend von 2-Aminothiophenol-5-carbonsäuren der allgemeinen Formel VIII ( $R = R' = H$ ) hergestellt werden.

Hierzu wird man die Verbindungen der allgemeinen Formel VIII zu-

5 nächst diazotieren, beispielsweise durch Umsetzung mit organi-

schem oder anorganischem Nitrit in einem wässrigen, neutralen Re-

aktionsmedium bei Temperaturen im Bereich von -15 bis +20°C. Die

wässrige Lösung oder Suspension des Diazoniumsalzes wird an-

schließend angesäuert, wobei sich die Verbindung der allgemeinen

10 Formel IV-5 bildet. Diese kann in konventioneller Weise aus der

Reaktionsmischung, beispielsweise durch Extraktion mit einem orga-

nischen Lösungsmittel, gewonnen werden. Die Herstellung der Aus-

gangsverbindungen VIII ist in Schema 1 beschrieben. Die Herstel-

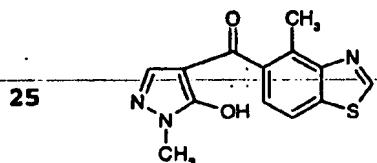
lung der Benzothiadiazolcarbonsäuren IV-5 ( $X = N, Y = S$ ) kann

15 beispielsweise in Anlehnung an das in der US 5,770,758 beschrie-

bene Verfahren erfolgen.

#### Beispiele

20 4-[4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl]-5-hydroxy-1-methylpyrazol  
(Beispiel 1)



#### 1.1 2-Methyl-4-thiocyanato-isophthalsäuredinitril

30 Unter Erwärmung wurden 189 g (1 Mol) 2-Methyl-3-cyano-4-thio-

cyanoanilin in 1 kg Eisessig gelöst und danach wurden 400 g

(4 Mol) konz. HCl und nach 15 min Rühren 400 ml Wasser zu so

zugefügt, daß eine feinverteilte Suspension des Hydrochlorids

entstand. Nach kurzem Rühren (15 bis 30 min) wurde bei -5 bis

35 0°C langsam eine Lösung von 69 g (1 Mol) Natriumnitrit in

140 ml Wasser zugetropft. In einem separatem Rührkolben wur-

den 245 g (5 Mol) NaCN in einer Mischung aus 1,5 l Wasser und

136 g (2 Mol) 25 proz. Ammoniakwasser gelöst und anschließend

40 250 g (1 Mol) CuSO<sub>4</sub>·5 H<sub>2</sub>O zugegeben. Danach wurden bei 25°C

eine zuvor bereitete und bei 0°C gehaltene Diazoniumlösung

zügig in den Cu-Komplex zugetropft, wobei die Temperatur 40°C

nicht überstieg. Nach Beendigung der Gasabspaltung wurde noch

30 min nachröhren gelassen. Man saugte den ausgefallenen

Feststoff ab und wusch ihn dreimal mit Wasser. Das Filtrat

45 wurde mit 2 l Methylenchlorid extrahiert. Der Feststoff wurde

dann in ein Rührgefäß gegeben und mit 1 l konz. HCl versetzt.

Anschließend goß man den Methylenchlorid-Extrakt zu und ließ

## 154

15 min röhren. Nach Abtrennen der organischen Phase und Abfiltrieren ungelöst gebliebener Anteile wurde dreimal mit Wasser gewaschen und nach Trocknung über Natriumsulfat eingeengt. Zur Abtrennung unerwünschter Bestandteile wurde das  
5 Rohprodukt in Ethylacetat gelöst, vom Ungelösten filtriert und die Lösung anschließend eingeengt. Ausbeute: 170 g (85%).  
Smp.: 95 - 107°C

## 1.2 3-Methyl-2,4-dicyanothiophenol

10 Zu einer Lösung von 170 g (0,85 Mol) 2 Methyl-4-thiocyanoisophthsäuredinitril in 850 ml Methanol, wurden bei 25 bis 35°C eine Lösung von 110,5 g (0,85 Mol) 60 proz. Natriumsulfid in 425 ml Wasser zugetropft und drei Stunden bei Raumtemperatur nachröhren gelassen. Danach wurde mit 1000 ml Wasser versetzt und mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Die wässrige Phase wurde durch Ansäuern mit HCl auf pH 1 gebracht und das Thiophenol mit Methylenchlorid extrahiert. Nach dreimaligem Waschen des Extraktes mit Wasser wurde die organische  
15 Phase abgetrennt, über Natriumsulfat getrocknet und eingeengt. Ausbeute: 150 g (99%).  
20 Smp.: 172 - 179°C

## 1.3 3-Methyl-2,4-dicyano-thioanisol

25 50g (0,29 Mol) 3-Methyl-2,4-dicyano-thiophenol wurden in eine Lösung von 23 g (0,58 Mol) NaOH in 400 ml Wasser gegeben und dann wurden bei 25 bis 35°C 73 g (0,58 Mol) Dimethylsulfat zugetropft. Nach 16 h Nachröhren bei 25°C war ein Feststoff  
30 ausgefallen, der abgesaugt wurde, zweimal mit Wasser gewaschen und dann aus Eisessig/Wasser umkristallisiert wurde.  
Ausbeute: 43 g (80%).  
Smp.: 176 - 181°C

## 35 1.4 2-Methyl-3-aminocarbonyl-4-methylsulfanylbenzoësäure

34g (0,181 Mol) 3-Methyl-2,4-dicyanothioanisol wurden in einer Lösung von 21,7 g (0,54 Mol) NaOH in 200 ml Wasser suspendiert und 8 h zum Sieden erhitzt. Nach dem Abkühlen fiel ein Teil des Produktes aus und wurde durch Absaugen und Waschen mit Wasser isoliert. Das noch alkalische Filtrat wurde mit MTBE extrahiert, der Extrakt wurde verworfen. Die wässrige Phase wurde mit konz. HCl angesäuert (pH 1) und mit Ethylacetat extrahiert. Ausbeute: 29 g (71%).  
45 Smp.: 230 - 240°C

**1.5 3-Amino-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäure**

a) aus 2-Methyl-3-aminocarbonyl-4-methylsulfanylbenzoësäure

5 Zu einer Lösung von 3,64 g NaOH (0,09 mol) in 40 ml Wasser wurden bei 0°C 2,9 g Brom (0,018 mol) getropft. Anschließend wurden 4,1 g 2-Methyl-3-aminocarbonyl-4-methylsulfanylbenzoësäure (0,018 mol) bei 0°C portionsweise zugegeben. Man ließ 1-h bei 0°C röhren und erwärmt danach auf 20°C. Anschließend wurde die Reaktionsmischung mit 10 %iger HCl sauer gestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Der anfallende Niederschlag wurde mehrmals mit Ethylacetat aufgeschlämmt und getrocknet. Ausbeute: 0,95 g (27%).

15 b) aus 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester

10 10 g 2-Amino-4-methyl-benzothiazol-5-carbonsäure-methylester (0,045 mol) wurden in einer Mischung aus 120 ml Wasser, 120 ml Ethylenglykol und 50 g NaOH gelöst und 20 h bei 130°C gerührt. Danach wurde mit 50 g Eis verdünnt, 3 Tropfen  $(n\text{-Bu})_4\text{N}^+\text{OH}^-$ -Lösung zugegeben und zum Schluß wurden bei 20°C 6,25 ml Dimethylsulfat (0,05 mol) in 15 ml Toluol zugegeben. Nach 30 min wurde mit konz. HCl angesäuert und der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Ausbeute: 7 g (71%).  
Smp.: 225°C (Zers.)

**1.6 3-Amino-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäuremethylester**

30 2 g 3-Amino-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäure (0,01 mol) wurden in 20 ml Methanol gelöst, mit 2,0 g konz. Schwefelsäure versetzt und für 2 h auf 60°C erwärmt. Nach dem Abkühlen wurde die Reaktionsmischung auf Wasser gegeben, neutralisiert und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen, Trocknen wurde das Lösungsmittel entfernt. Ausbeute: 1,3 g (62%).  
Smp.: 98 – 103°C

**1.7 3-Formamidyl-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäuremethylester**

40 Zu einer Mischung aus 30 ml Essigsäureanhydrid und 2,2 g Ameisensäure (0,05 mol) wurde bei 40°C portionsweise 4,75 g 3-Amino-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäuremethylester (0,05 mol) gegeben. Nach 5 h ließ man abkühlen, gab die Lösung auf Eisswasser und extrahierte erschöpfend mit Methylenechlorid.  
45 Die organischen Phasen wurden gewaschen, getrocknet und anschließend wurde das Lösungsmittel entfernt. Ausbeute: 4,7 g (0,044 mol).

156

Smp.: 170 – 176°C

**1.8 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester**

- 5        a) aus 3-Formamidyl-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäuremethylester

10        2,4 g 3-Formamidyl-2-methyl-4-methylsulfanylbenzoësäuremethylester (0,01 mol) wurden in Methylenchlorid gelöst. Phosgen wurde bis zur Sättigung eingegast und anschließend wurde überschüssiges Phosgen mit Stickstoff vertrieben. Danach wurden 1,5 g Triethylamin zugetropft. Nach Entfernen des Lösungsmittels im Vakuum wurde der Rückstand in Ethylacetat aufgenommen, das Salz abfiltriert und die organische Phase erneut eingeengt. Der Rückstand wurde säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt. Ausbeute: 1,6 g (77%).

- b) aus 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester

20        15 g 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester (0,07 mol) wurden in 450 ml Phosphorsäure vorgelegt und auf -8°C abgekühlt. Dann wurden 27,9 g NaNO<sub>2</sub> (0,4 mol) in 30 ml Wasser so zugetropft, daß die Temperatur nicht über -4°C stieg. Anschließend wurde das Diazoniumsalz bei 5 bis 10°C zu 169 ml Hypophosphoriger Säure getropft und über Nacht bei 20°C gerührt. Anschließend wurde die Reaktionslösung neutralisiert und erschöpfend mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phasen wurde das Lösungsmittel entfernt. Ausbeute: 6,84 g (49%).

30        Smp.: 90 – 92°C

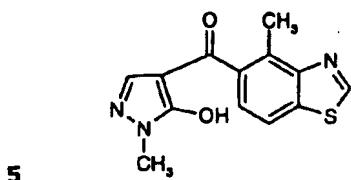
**1.9 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäure**

35        16,6 g 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäure-methylester (0,08 mol) wurden in 280 ml 5 fäig Kalilauge gelöst und für 2,5 h auf Rückfluß erhitzt. Nach dem Abkühlen wird mit Phosphorsäure sauer gestellt. Das Produkt wurde abfiltriert und anschließend getrocknet. Ausbeute: 14,34 g (93%).

40        Smp.: 260 – 265°C

**1.10 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5-yl)-ester**

157



0,65 g 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäure (0,004 mol) und  
0,33 g 1-Methyl-5-hydroxy-pyrazol (0,004 mol) wurden in 30 ml  
abs. Acetonitril gelöst und mit 0,65 g EDC (0,004 mol),  
10 0,5 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach  
beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und  
mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der or-  
ganischen Phase wurde das Produkt durch säulenchromatogra-  
phisch an Kieselgel gereinigt. Ausbeute: 0,42 g (41%).  
15  $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS):  $\delta = 3,18$  (s, 3H); 3,83 (s, 3H); 6,24 (d,  
1H); 7,49 (d, 1H); 7,94 (d, 1H); 8,21 (d, 1H); 9,08 (s, 1H)  
ppm.

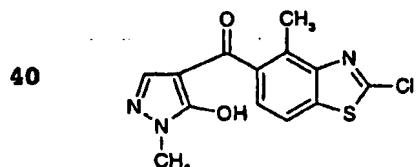
EDC = Ethyl-(3'-Dimethylaminopropyl)carbodiimid

20 DMAP = 4-Dimethylaminopyridin

1.11 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-me-  
thylypyrazol

25 0,38 g 4-Methylbenzothiazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyra-  
zol-5-yl)-ester (1,39 mmol) wurden in 25 ml Dioxan gelöst und  
mit 0,28 g  $\text{K}_2\text{CO}_3$  (2 mmol) versetzt. Man refluxierte bis zum  
vollständigen Umsatz, entfernte das Lösungsmittel im Vakuum  
und nahm den Rückstand mit Wasser auf. Die wässrige Phase  
30 wurde mit Methylenchlorid extrahiert, auf pH 2 eingestellt  
und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Entfernen des Lösungs-  
mittels wurde das Produkt durch Ausröhren gereinigt. Aus-  
beute: 0,25 g (66%)  
Smp.: 149 - 150°C

35 4-(2'-Chlor-4'-methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-me-  
thylypyrazol (Beispiel 2)



45 2.1 3-Amino-2-methylbenzoësäuremethylester

158

210 g 2-Methyl-3-nitrobenzoësäuremethylester (1,08 mol) wurden in 4 l Methanol gelöst, mit 21 g Pd/C versetzt und anschließend bei Raumdruck hydriert. Nach beendeter Reaktion wurde vom Katalysator abfiltriert und das Lösungsmittel entfernt. Ausbeute: 178 g (quant.).

5            $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS):  $\delta = 2,34$  (s, 3H); 3,60 (s, br, 2H,  $\text{NH}_2$ ); 3,84 (s, 3H); 6,80 (d, 1H); 7,04 (dd, 1H); 7,21 (d, 1H) ppm.

## 2.2 N-(2-Methyl-3-methoxycarbonylphenyl)thioharnstoff

10           90,7 g 3-Amino-2-methylbenzoësäuremethylester (0,55 mol) wurden in 510 ml Chlorbenzol gelöst und bei  $-5^\circ\text{C}$  mit 14 ml konz. Schwefelsäure und 49 g Natriumrhodanid (0,6 mol) versetzt. Anschließend wurden 2 ml 15-Krone-5 zugegeben und die Reaktionsmischung wird für 13 h auf  $100^\circ\text{C}$  erhitzt. Nach dem Abkühlen wurde der Feststoff abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Ausbeute: 104,8 g (85%).

15           Smp.: 198°C

## 20 2.3 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester

25           56 g N-(2-Methyl-3-methoxycarbonylphenyl)thioharnstoff (0,25 mol) wurden in 2 l Chlorbenzol gelöst und auf  $0^\circ\text{C}$  abgekühlt. Anschließend wurden 40 g Brom (0,25 mol) in 100 ml Chlorbenzol zugetropft. Die Reaktionsmischung wurde für 3 h auf  $90^\circ\text{C}$  erhitzt, der Niederschlag abgesaugt und mit Methylchlorid gewaschen. Anschließend wurde er in Ethylacetat gelöst und mit Natriumhydrogencarbonat-Lösung ausgeschüttelt. Nach Waschen und Trocknen wurde das Produkt durch Entfernen des Lösungsmittels erhalten. Ausbeute: 43 g (80%).

30           Smp.: 220°C

## 2.4 2-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester

35           Zu einer Lösung von 5 g 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester (0,02 mol) in 150 ml Phosphorsäure wurde bei  $-8^\circ\text{C}$  eine Lösung von 9,3 g  $\text{NaNO}_2$  (0,14 mol) in 10 ml Wasser getropft. Anschließend wurde bei  $5^\circ\text{C}$  eine Lösung aus 3 g  $\text{CuCl}$  und 12 ml konz. HCl zugetropft. Die Reaktionsmischung wurde auf  $100^\circ\text{C}$  erwärmt. Nach dem Abkühlen wird der Rückstand abgesaugt, mit Wasser gewaschen und getrocknet. Das Produkt wurde durch Säulenchromatographie an Kieselgel gereinigt. Ausbeute: 3 g (55, %).

40            $^1\text{H-NMR}$  ( $\text{CDCl}_3$ , TMS)  $\delta = 2,98$  (s, 3H); 3,95 (s, 3H); 7,67 (d, 1H); 7,95 (d, 1H) ppm.

45

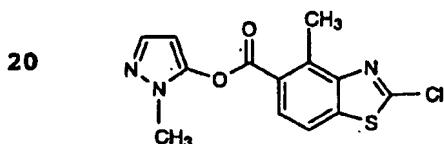
159

**2.5 2-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäure**

3 g 2-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester (0,012 mol) wurden in 50 ml THF gelöst, auf 0°C abgekühlt und  
 5 mit einer Lösung von 0,6 g LiOH in 20 ml Wasser versetzt.  
 Nach 1 h ließ man auf 20°C erwärmen und rührte weitere 20 h nach. Anschließen wurde das Lösungsmittel im Vakuum entfernt, die wässrige Phase mit Phosphorsäure angesäuert und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen wird das  
 10 Produkt durch Entfernen des Lösungsmittels erhalten. Ausbeute: 2,6 g (92%).  
 Smp.: >250°C  
 $^1\text{H-NMR}$  (D<sub>6</sub>-DMSO, TMS) δ = 2,85 (s, 3H); 7,90 (d, 1H); 8,02 (d, 1H) ppm.

15

**2.6 3-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5'-yl)ester**



25

1 g 3-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäure (4,4 mol) und 0,46 g 1-Methyl-5-hydroxy-pyrazol (4,7 mol) wurden in 50 ml abs. Acetonitril gelöst und mit 1 g EDC, 0,7 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phase wurde das Produkt durch Kristallisation/Säulenchromatographie gereinigt. Ausbeute: 0,22 g (16%).  
 $^1\text{H-NMR}$  (CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ = 3,08 (s, 3H); 3,80 (s, 3H); 6,25 (s, 1H); 7,46 (s, 1H); 7,77 (d, 1H); 8,17 (d, 1H) ppm.

35

**2.7 4-(3'-Chlor-4'-methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol**

40

0,22 g 3-Chlor-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5-yl)-ester (0,7 mol) wurden in 35 ml Dioxan gelöst und mit 0,5 g K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> versetzt. Man refluxierte bis zum vollständigen Umsatz, entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und nahm den Rückstand mit Wasser auf. Die wässrige Phase wurde mit Methylenchlorid extrahiert, auf pH 2 eingestellt

45

160

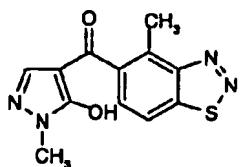
und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Entfernen des Lösungsmittels wurde das Produkt durch Ausröhren gereinigt. Ausbeute: 0,19 g (86%).

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, TMS) δ = 2,82 (s, 3H); 3,76 (s, 3H); 7,40 (s, 5H); 7,52 (d, 1H); 7,73 (d, 1H) ppm.

4-(4'-Methylbenzothiadiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 3)

10

15



3.1 4-Methylbenzothiadiazol-5-carbonsäure

20

5 g 2-Amino-4-methylbenzothiazol-5-carbonsäuremethylester (0,02 mol) wurden in 28,6 g 50 %iger KOH bei 120°C 4 h gerührt. Anschließend wurde mit 10 %iger HCl neutralisiert und mit einem Überschuß 40 %iger NaNO<sub>2</sub>-Lösung bei 0 bis 10°C versetzt. Die Reaktionsmischung wurde angesäuert und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen wurde das Produkt durch Entfernen des Lösungsmittels erhalten. Ausbeute: 1,3 g (28%).

30

3.2 4-(4'-Methylbenzothiadiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol

35

1,3 g 4-Methylbenzothiadiazol-5-carbonsäure (6,3 mmol) und 0,65 g 1-Methyl-5-hydroxy-pyrazol (6,6 mmol) wurden in 50 ml abs. Acetonitril gelöst und mit 1,4 g EDC (7,5 mmol), 1 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phase wurde das Produkt säulenchromatographisch an Kieselgel gereinigt. Ausbeute: 0,7 g (39%).

40

Smp.: 152-153°C

45

3.3 4-(4'-Methylbenzothiadiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol

0,7 g 4-Methyl-benzothiadiazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5-yl)-ester (2,4 mmol) wurden in 40 ml Dioxan gelöst und mit 0,5 g K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> versetzt. Man refluxierte bis zum vollständigen Umsatz, entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und nahm

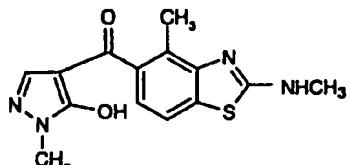
161

den Rückstand mit Wasser auf. Die wässrige Phase wurde mit Methylenechlorid extrahiert, auf pH 2 eingestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Entfernen des Lösungsmittels wurde das Produkt durch Ausröhren gereinigt. Ausbeute: 0,65 g (93%).

Smp.: 207-209°C

**4-(2'-Methylamino-4'-methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 4)**

10



15

**4.1 2-Methylamino-4-methyl-benzothiazol-5-carbonsäure**

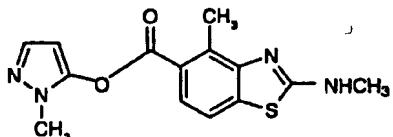
20

99 g 3-Amino-2-methylbenzoësäure (0,655 mol) aus wurden in 500 ml Essigsäure vorgelegt und bei 80°C mit 51 g Methylisothiocyanat (7 mol) in 100 ml Essigsäure versetzt. Nach 2 h wurden 106 g Brom (0,66 mol) in 20 ml Essigsäure bei 50°C zugeropft. Anschließend wurde für 2 h ca. 100°C erhitzt und nach beendet Reaktion abkühlen lassen. Der Niederschlag wurde abfiltriert, das Filtrat auf ca. 50 ml eingeengt und das restliche Filtrat sowie den Niederschlag auf Wasser gegeben. Die wässrige Phase wurde auf pH 5 eingestellt und bei 80°C wurde der Niederschlag abfiltriert. Anschließend wurde dieser mit Wasser gewaschen und getrocknet. Ausbeute: 66 g (42%).

<sup>1</sup>H-NMR (D<sub>6</sub>-DMSO, TMS) δ = 2,72 (s, 3H); 2,95 (d, 3H); 7,46 (d, 1H); 7,57 (d, 1H); 8,04 (q, 1H, NH) ppm.

**4.2 2-Methylamino-4-methyl-benzothiazol-5-carbonsäure-(1'-methyl-pyrazol-5-yl)-ester**

40



45

162

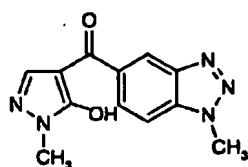
3,1 g 2-Methylamino-4-methyl-benzothiazol-5-carbonsäure (0,014 mol) und 1,4 g 1-Methyl-5-hydroxypyrazol (0,015 mol) wurden in 110 ml abs. Acetonitril gelöst und mit 2,67 g EDC (0,014 mol), 1,2 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phase wurde das Produkt durch Kristallisation gereinigt. Ausbeute: 2,2 g (52%).

<sup>1</sup>H-NMR (D<sub>6</sub>-DMSO): δ = 2,80 (s, 3H); 3,00 (d, 3H); 3,73 (s, 3H); 6,22 (d, 1H); 7,43 (d, 1H); 7,72 (d, 1H); 7,84 (d, 1H); 8,20 (s, br, 1H) ppm.

**4-(1'-Methylbenzotriazol-5-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol  
(Beispiel 5)**

15

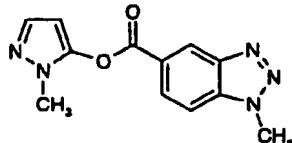
20



**5.1 1-Methylbenzotriazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5-yl)ester**

25

30



1,5 g 1-Methylbenzotriazol-5-carbonsäure (8,5 mmol) und 0,87 g 1-Methyl-5-hydroxy-pyrazol (8,9 mmol) wurden in 70 ml abs. Acetonitril gelöst und mit 1,62 g EDC (8,5 mmol), 2 ml Triethylamin und einer kat. Menge DMAP versetzt. Nach beendeter Reaktion wurde die Lösung auf Wasser gegeben und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der organischen Phase wurde das Produkt durch Kristallisation gereinigt. Ausbeute: 0,77 g (35%).

<sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, TMS): δ = 3,82 (s, 3H); 4,40 (s, 3H); 6,28 (d, 1H); 7,48 (d, 1H); 7,67 (d, 1H); 8,36 (d, 1H); 8,98 (s, 1H) ppm.

45

5.2 4-(1'-Methylbenzotriazol-5-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol

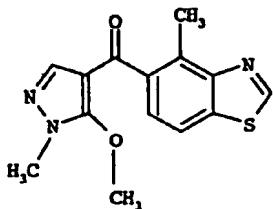
5      0,53 g 1-Methyl-benzotriazol-5-carbonsäure-(1'-methylpyrazol-5-yl)-ester (2 mmol) wurden in 30 ml Dioxan gelöst und mit 0,43 g K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> (3 mmol) versetzt. Man refluxierte bis zum vollständigen Umsatz, entfernte das Lösungsmittel im Vakuum und nahm den Rückstand mit Wasser auf. Die wässrige Phase wurde mit Methylenechlorid extrahiert, auf pH 2 eingestellt und mit Ethylacetat extrahiert. Nach Entfernen des Lösungsmittels wurde das Produkt durch Ausröhren gereinigt. Ausbeute: 0,31 g (58%).

10     <sup>1</sup>H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, TMS): δ = 3,78 (s, 3H); 4,39 (s, 3H); 4,75 (s, br, 1H); 7,63 (d, 1H); 7,86 (s, 1H); 8,08 (d, 1H); 8,56 (s, 1H) ppm.

15     1H-NMR (CDCl<sub>3</sub>, TMS): δ = 3,78 (s, 3H); 4,39 (s, 3H); 4,75 (s, br, 1H); 7,63 (d, 1H); 7,86 (s, 1H); 8,08 (d, 1H); 8,56 (s, 1H) ppm.

20     6. 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-methoxy-1-methylpyrazol (Beispiel 6)

25



30     Zu einer Mischung aus 0,3 g 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol aus Beispiel 1 und 0,18 g Kaliumcarbonat in 15 ml Dimethylformamid wurden bei Raumtemperatur 0,26 g Iodmethan getropft. Die Mischung wurde 75 min bei 50°C und über Nacht bei Raumtemperatur gerührt. Zur Aufarbeitung wurde die Reaktionsmischung auf Wasser gegeben und mit Methyl-tert.-butylether extrahiert. Nach Waschen und Trocknen der vereinigten organischen Phasen und Entfernen des Lösungsmittels erhielt man die Verbindung I-1e.394 in Form weißlich-gelber Kristalle. Ausbeute: 0,15 g (48%).

35     Smp.: 138-141°C.

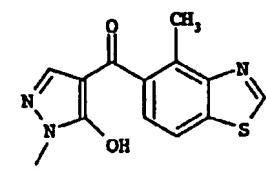
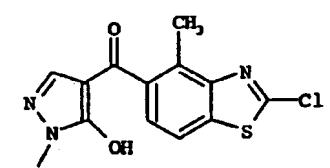
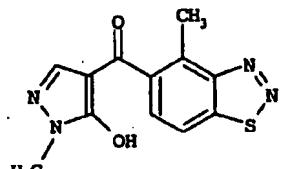
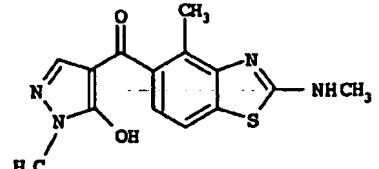
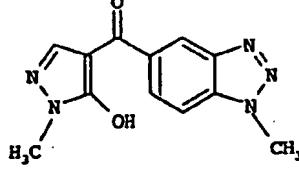
40

In analoger Weise wurden durch Umsetzung der Verbindung I-1a.394 aus Beispiel 1 mit Benzylbromid die Verbindung des Beispiels 13 (I-1g.394) und durch Umsetzung mit dem jeweiligen Säurechlorid die Verbindungen I-1i.394 (Beispiel 16), I-1u.394 (Beispiel 15) und I-1v.394 (Beispiel 18) hergestellt.

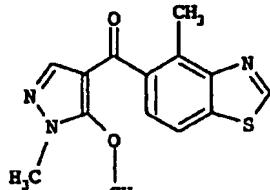
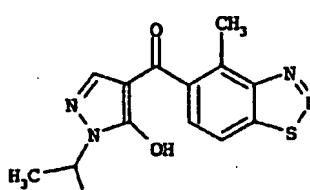
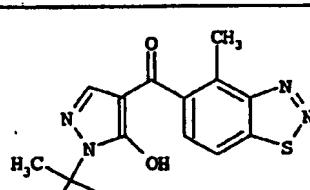
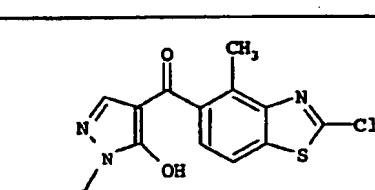
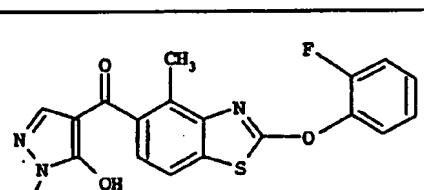
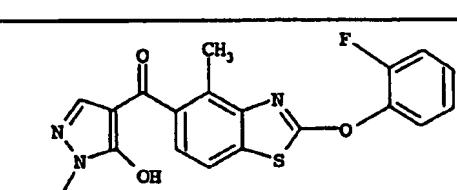
164

Die Verbindungen der Beispiele 7 bis 12, 14, 17 und 19 bis 52 wurden analog der in Beispiel 1, Schritte 1.10 und 1.11 beschriebenen Sequenz durch Umsetzung der jeweiligen Carbonsäure IVb mit dem entsprechenden 5-Hydroxypyrazol III hergestellt.

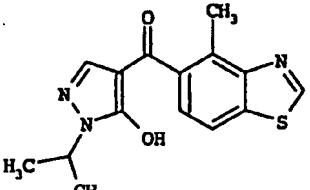
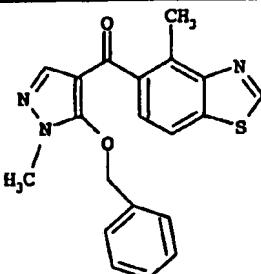
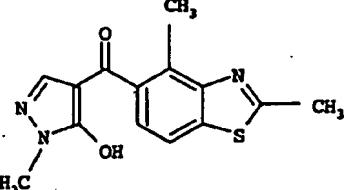
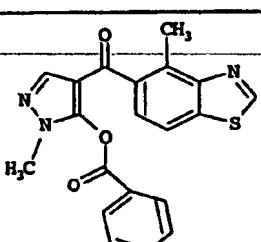
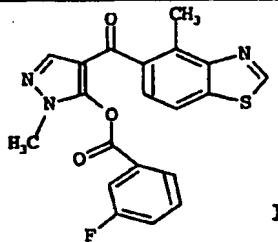
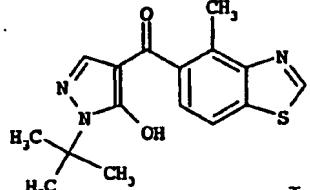
5

Bsp.	Struktur / Verbindung-Nr.	Smp. [°C] oder <sup>1</sup> H-NMR [ppm]
10		
15	 I-1a.394	149-150 °C
20	 I-1a.396	135-137 °C
25		
30	 I-4a.2	207-209 °C
35		
40	 I-1a.447	--
45	 I-4a.38	CDCl <sub>3</sub> , TMS: 3.78 (s, 3H), 4.39 (s, 3H), 4.75 (OH), 7.63 (d, 1H), 7.86 (s, 1H), 8.08 (d, 1H), 8.56 (s, 1H) ppm.

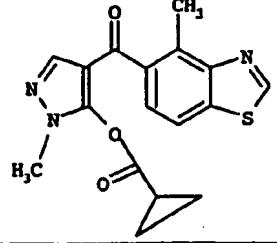
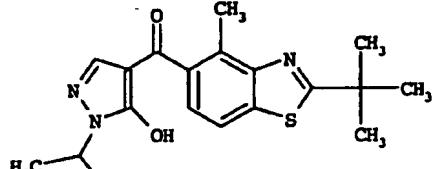
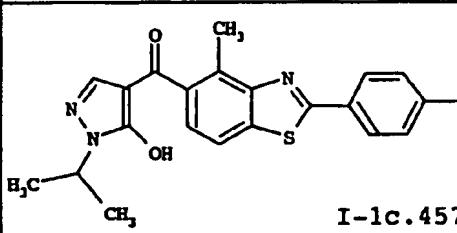
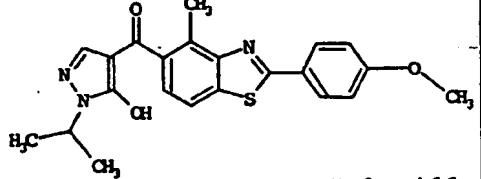
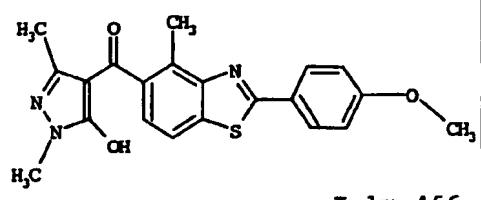
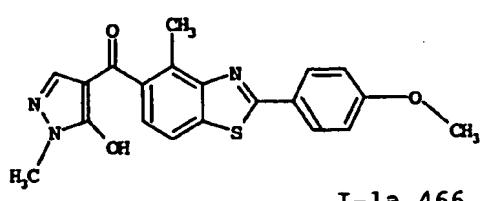
165

5 6	 I-1e.394	138-141 °C
10 7	 I-4c.2	141-143 °C
15 8	 I-4d.2	122-125 °C
20 9	 I-1c.396	118-122 °C
25 10	 I-1a.790	CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.6 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 5.5 (OH), 7.2 - 7.38 (m, 3H), 7.4 - 7.55 (m, 3H), 7.6 (d, 1H) ppm.
30 11	 I-1c.790	CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.55 (d, 6H), 2.62 (s, 3H), 4.6 (m, 1H), 5.5 (OH), 7.2 - 7.38 (m, 3H), 7.4 - 7.55 (m, 3H), 7.6 (d, 1H) ppm.

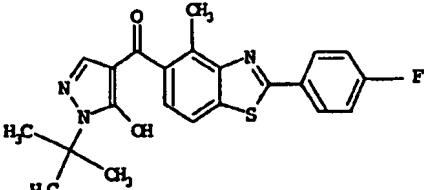
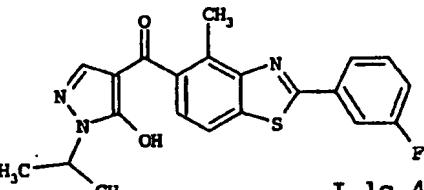
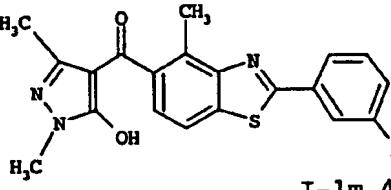
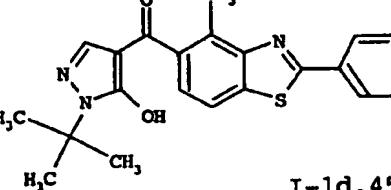
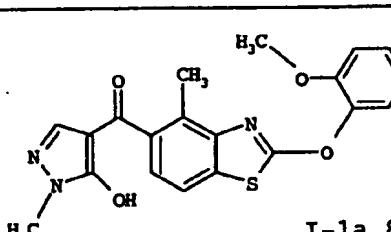
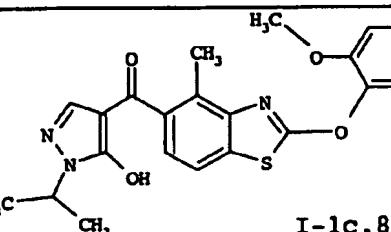
166

5	12		135-137 °C
10	13		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.81 (s, 3H), 3.79 (s, 3H), 5.2 (s, 2H), 7.08 (d, 1H), 7.2 - 7.45 (m, 6H), 7.65 (d, 1H), 9.1 (s, 1H) ppm.
15	14		148-152 °C
20	15		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.78 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 7.25 - 7.55 (m, 4H), 7.65 (d, 1H), 7.8 - 7.9 (m, 3H), 8.9 (s, 1H) ppm.
25	16		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.78 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 7.2 - 7.38 (m, 3H), 7.58 (d, 1H), 7.67 - 7.78 (m, 2H), 7.82 (s, 1H), 8.99 (s, 1H) ppm.
30	17		98-101 °C
35			
40			
45			

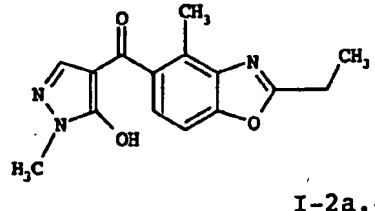
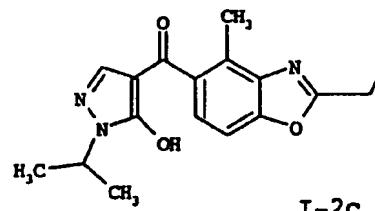
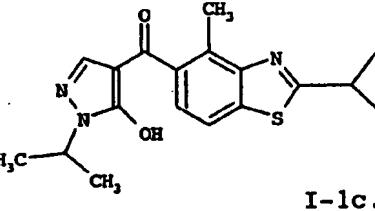
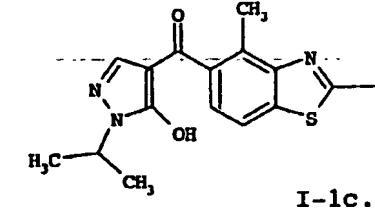
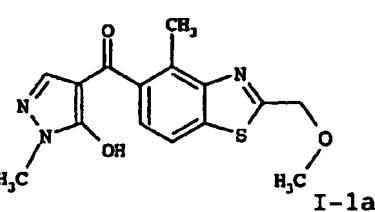
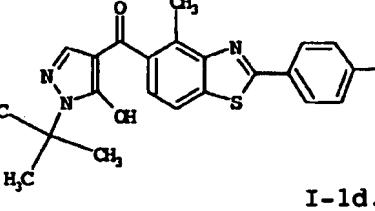
167

5	18		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 0.8 (m, 2H), 1.05 (m, 2H), 1.66 (m, 1H), 2.8 (s, 3H), 3.75 (s, 3H), 5.6 (OH), 7.45 (d, 1H), 7.8 (s, 1H), 7.82 (d, 1H), 9.03 (s, 1H) ppm.
10	19		145-148 °C
15	20		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.58 (d, 6H), 2.90 (s, 3H), 4.62 (m, 1H), 7.2 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.54 (d, 1H), 7.8 (d, 1H), 8.14 (m, 2H) ppm.
20	21		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.56 (d, 6H), 2.92 (s, 3H), 3.9 (s, 3H), 4.62 (m, 1H), 7.02 (d, 2H), 7.46 (s, 1H), 7.5 (d, 1H), 7.80 (d, 1H), 8.08 (d, 2H) ppm.
25	22		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.72 (s, 3H), 2.88 (s, 3H), 3.64 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 7.0 (m, 2H), 7.22 (d, 1H), 7.78 (d, 1H), 8.06 (d, 2H) ppm.
30	23		204-205 °C
35			
40			

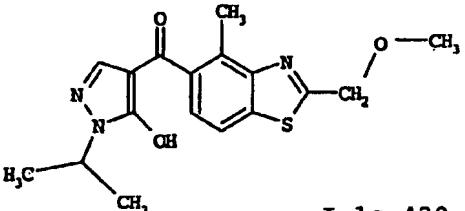
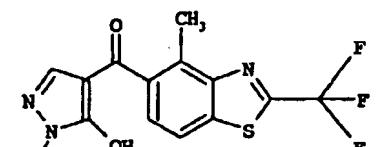
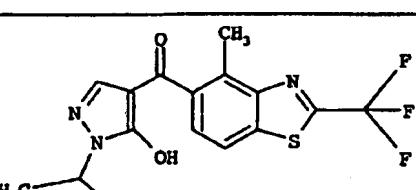
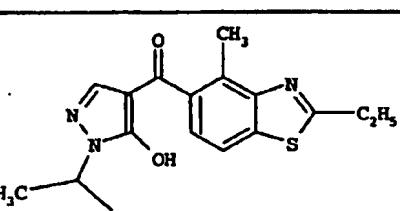
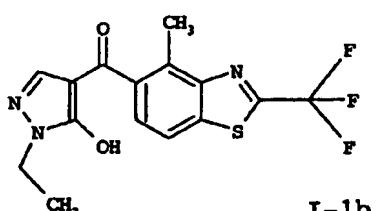
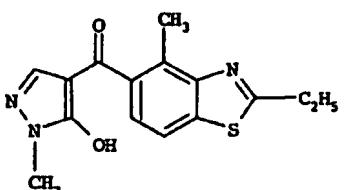
168

24		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.64 (s, 9H), 2.92 (s, 3H), 7.20 (m, 2H), 7.48 (s, 1H), 7.62 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 8.16 (m, 2H) ppm.  I-1d.457
25		127-128 °C  I-1c.456
26		123-127 °C  I-1m.456
27		153-154 °C  I-1d.456
28		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.78 (s, 3H), 3.78 (s, 3H), 3.88 (s, 3H), 7.0 - 7.12 (m, 2H), 7.2 - 7.4 (m, 4H), 7.46 (d, 1H), 8.85 (OH) ppm.  I-1a.802
29		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.61 (d, 6H), 2.80 (s, 3H), 3.90 (s, 3H), 4.63 (m, 1H), 7.0 - 7.12 (m, 2H), 7.25 - 7.48 (m, 4H), 7.55 (d, 1H), 8.95 (OH) ppm.  I-1c.802

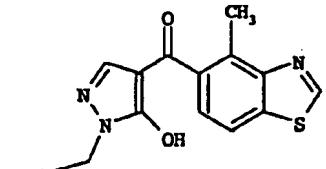
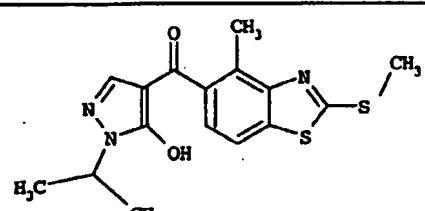
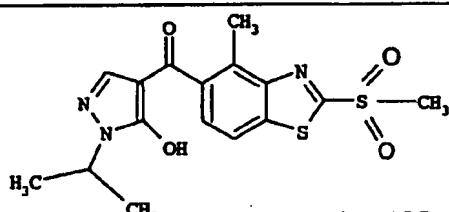
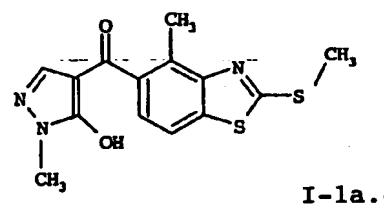
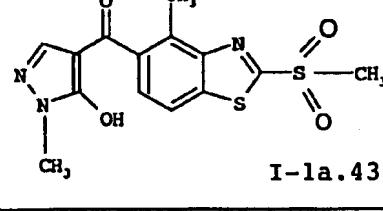
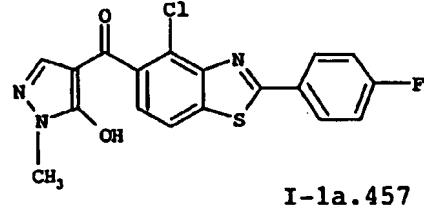
169

5	30  I-2a.406	134-137 °C
10	31  I-2c.406	CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.53 (t, 3H), 1.55 (d, 6H), 2.78 (s, 3H), 3.03 (q, 2H), 4.62 (m, 1H), 7.38 (d, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.53 (d, 1H) ppm.
15	32  I-1c.408	102-105 °C
20	33  I-1c.405	107-110 °C
25	34  I-1a.420	CDCl <sub>3</sub> , TMS: 2.82 (s, 3H), 3.58 (s, 3H), 3.70 (s, 3H), 4.88 (s, 2H); 742 (s, 1H), 7.52 (d, 1H), 7.82 (d, 1H), 7.90 (OH) ppm.
30	35  I-1d.475	197-200 °C

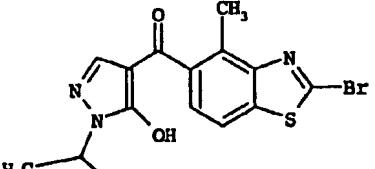
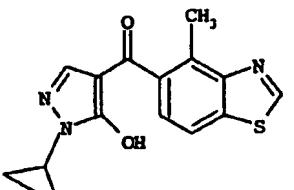
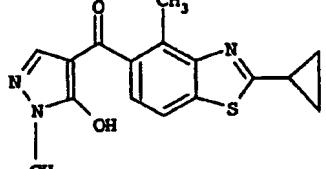
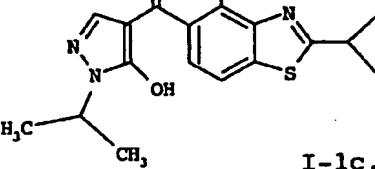
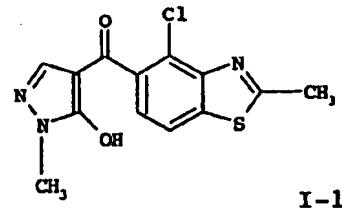
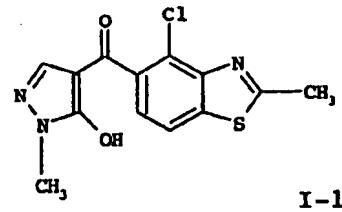
170

5 36	 I-1c.420	100-104 °C
10 37	 I-1a.418	108-112 °C
15 38	 I-1c.418	84-87 °C
20 39	 I-1c.406	105-107 °C
25 40	 I-1b.418	81-85 °C
30 41	 I-1a.406	125-128 °C

171

5	42		105-110 °C
10	43		139-143 °C
15	44		172-177 °C
20	45		138-144 °C
25	46		208-210 °C
30	47		235-236 °C

172

5 48		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.55 (d, 6H), 2.82 (s, 3H), 4.61 (m, 1H), 7.39 (s, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.77 (d, 1H) ppm.
10 49		CDCl <sub>3</sub> , TMS: 1.08 (m, 2H), 1.22 (m, 2H), 2.90 (s, 3H), 3.40 (m, 1H), 7.38 (s, 1H), 7.56 (d, 1H), 7.90 (d, 1H), 8.95 (OH), 9.03 (s, 1H) ppm.
15 50		69-71 °C
20 51		115-118 °C
25 52		141-144 °C
30 35 52		

40

45

Die Verbindungen der Formel I und deren landwirtschaftlich brauchbaren Salze eignen sich sowohl als Isomerengemische als auch in Form der reinen Isomeren - als Herbizide. Die herbiziden Mittel, die Verbindungen der Formel I enthalten, bekämpfen Pflanzenwuchs auf Nichtkulturflächen sehr gut, besonders bei hohen Aufwandmengen. In Kulturen wie Weizen, Reis, Mais, Soja und Baumwolle wirken sie gegen Unkräuter und Schadgräser, ohne die Kulturpflanzen nennenswert zu schädigen. Dieser Effekt tritt vor allem bei niedrigen Aufwandmengen auf.

10

In Abhängigkeit von der jeweiligen Applikationsmethode können die Verbindungen der Formel I bzw. sie enthaltenden herbiziden Mittel noch in einer weiteren Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden. In Betracht kommen beispielsweise folgende Kulturen:

Allium cepa, Ananas comosus, Arachis hypogaea, Asparagus officinalis, Beta vulgaris spec. altissima, Beta vulgaris spec. rapa, Brassica napus var. napus, Brassica napus var. rapa, Brassica rapa var. silvestris, Camellia sinensis, Carthamus tinctorius, Carya illinoiensis, Citrus limon, Citrus sinensis, Coffea arabica (Coffea canephora, Coffea liberica), Cucumis sativus, Cynodon dactylon, Daucus carota, Elaeis guineensis, Fragaria vesca, Glycine max, Gossypium hirsutum, Gossypium arboreum, Gossypium herbaceum, Gossypium vitifolium), Helianthus annuus, Hevea brasiliensis, Hordeum vulgare, Humulus lupulus, Ipomoea batatas, Juglans regia, Lens culinaris, Linum usitatissimum, Lycopersicon lycopersicum, Malus spec., Manihot esculenta, Medicago sativa, Musa spec., Nicotiana tabacum (N.rustica), Olea europaea, Oryza sativa, Phaseolus lunatus, Phaseolus vulgaris, Picea abies, Pinus spec., Pisum sativum, Prunus avium, Prunus persica, Pyrus communis, Ribes sylvestre, Ricinus communis, Saccharum officinarum, Secale cereale, Solanum tuberosum, Sorghum bicolor (s. vulgare), Theobroma cacao, Trifolium pratense, Triticum aestivum, Triticum durum, Vicia faba, Vitis vinifera und Zea mays.

Darüber hinaus können die Verbindungen der Formel I auch in Kulturen, die durch Züchtung einschließlich gentechnischer Methoden gegen die Wirkung von Herbiziden tolerant sind, verwandt werden.

Die Verbindungen der Formel I bzw. die sie enthaltenden herbiziden Mittel können beispielsweise in Form von direkt versprühbaren wässrigen Lösungen, Pulvern, Suspensionen, auch hochprozentigen wässrigen, ölichen oder sonstigen Suspensionen oder Dispersionen, Emulsionen, Öldispersionen, Pasten, Stäubemitteln, Streumitteln oder Granulaten durch Versprühen, Vernebeln, Ver-

174

stäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungsformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall möglichst die feinste Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

5

Die herbiziden Mittel enthalten eine herbizid wirksame Menge mindestens einer Verbindung der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I und in der Regel die für die Formulierung von Pflanzenschutzmitteln üblichen Hilfsmittel.

10

Als inerte Hilfsstoffe kommen im Wesentlichen in Betracht:

Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt wie Kerosin und Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen 15 oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Paraffin, Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline und deren Derivate, alkylierte Benzole oder deren Derivate, Alkohole wie Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol und Cyclohexanol, Ketone wie Cyclohexanon, stark polare 20 Lösungsmittel, z.B. Amine wie N-Methylpyrrolidon und Wasser.

Wäßrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Suspensionsen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispersierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitet werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die 25 Verbindungen der Formel I als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispersier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispersier- oder 30 Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Als oberflächenaktive Stoffe kommen die Alkali-, Erdalkali-, 35 Ammoniumsalze von aromatischen Sulfonsäuren, z.B. Lignin-, Phenol-, Naphthalin- und Dibutylnaphthalinsulfonsäure, sowie von Fettsäuren, Alkyl- und Alkylarylsulfonaten, Alkyl-, Laurylether- und Fettalkoholsulfaten, sowie Salze sulfatierter Hexa-, Hepta- und Octadecanolen sowie von Fettalkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte Naphthalin und seiner Derivate mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfonsäuren mit Phenol und Formaldehyd, Polyoxyethylenoctylphenolether, ethoxyliertes Isooctyl-, Octyl- oder Nonylphenol, Alkylphenyl-, Tributylphenylpolyglykolether, Alkyl-45 arylpolyetheralkohole, Isotridecylalkohol, Fettalkoholethylenoxid-Kondensate, ethoxyliertes Rizinusöl, Polyoxyethylen- oder Polyoxypropylenalkylether, Laurylalkoholpolyglykoletheracetat,

175

Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen oder Methylcellulose in Betracht.

Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulate können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineraleerde wie Kiesel säuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte wie Getreidemehl, Baumrin den-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Konzentrationen der Verbindungen der Formel I in den anwendungsfertigen Zubereitungen können in weiten Bereichen variiert werden. Im allgemeinen enthalten die Formulierungen etwa von 0,001 bis 98 Gew.-%, vorzugsweise 0,01 bis 95 Gew.-%, mindestens eines Wirkstoffs. Die Wirkstoffe werden dabei in einer Reinheit von 90% bis 100%, vorzugsweise 95% bis 100% (nach NMR-Spektrum) eingesetzt.

Die folgenden Formulierungsbeispiele verdeutlichen die Herstellung solcher Zubereitungen:

- 30 I. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen alkyliertem Benzol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- 40 II. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungssproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Rizinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in

176

100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.

- III. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteilen einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280°C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalinsulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kieselsäuregelpulpa gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- V. 3 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.-% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 20 Gewichtsteile der jeweiligen Verbindung der Formel I werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkoholpolyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.
- VII. 1 Gewichtsteil der jeweiligen Verbindung der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 70 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 20 Gewichtsteilen ethoxyliertem Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen ethoxyliertem Rizinusöl besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.
- VIII. 1 Gewichtsteil der jeweiligen Verbindung der Formel I wird in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Cyclohexanon und 20 Gewichtsteilen Wetton<sup>R</sup> EM 31 (= nicht-ionischer Emulgator auf der Basis von ethoxyliertem Rizinusöl) besteht. Man erhält ein stabiles Emulsionskonzentrat.

177

Die Applikation der Verbindungen der Formel I bzw. der herbiziden Mittel kann im Vorauflauf- oder im Nachauflaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

Die Aufwandmengen an Verbindung der Formel I betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 3,0 vorzugsweise 0,01 bis 1,0 kg/ha aktive Substanz 15 (a.S.).

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner 1,2,4-Thiadiazole, 1,3,4-Thiadiazole, Amide, Aminophosphorsäure und deren Derivate, Aminotriazole, Anilide, Aryloxy-/Heteroaryl-oxyalkansäuren und deren Derivate, Benzoësäure und deren 25 Derivate, Benzothiadiazinone, 2-Aroyl-1,3-cyclohexandione, Heteroaryl-Aryl-Ketone, Benzylisoxazolidinone, meta-CF<sub>3</sub>-Phenyl-derivate, Carbamate, Chinolincarbonsäure und deren Derivate, Chloracetanilide, Cyclohexan-1,3-dion-Derivate, Cyclohexenonoximetherderivate, Diazine, Dichlorpropionsäure und deren Derivate, 30 Dihydrobenzofurane, Dihydrofuran-3-one, Dinitroaniline, Dinitrophenole, Diphenylether, Dipyridyle, Halogencarbonsäuren und deren Derivate, Harnstoffe, 3-Phenyluracile, Imidazole, Imidazolinone, N-Phenyl-3,4,5,6-tetrahydphthalimide, Oxadiazole, Oxirane, Phenole, Aryloxy- und Heteroaryloxyphenoxypropionsäureester, 35 Phenyllessigsäure und deren Derivate, 2-Phenylpropionsäure und deren Derivate, Pyrazole, Phenylpyrazole, Pyridazine, Pyridin-carbonsäure und deren Derivate, Pyrimidylether, Sulfonamide, Sulfonylharnstoffe, Triazine, Triazinone, Triazolinone, Triazol-carboxamide und Uracile in Betracht.

40 Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen der Formel I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt, gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder 45 phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können

178

auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

#### Anwendungsbeispiele

5 Die herbizide Wirkung der erfindungsgemäßen Verbindungen der Formel I ließ sich durch die folgenden Gewächshausversuche zeigen:

Als Kulturgefäße dienten Plastikblumentöpfe mit lehmigem Sand mit etwa 3,0 % Humus als Substrat. Die Samen der Testpflanzen wurden 10 nach Arten getrennt eingesät.

Bei Vorauflaufbehandlung wurden die in Wasser suspendierten oder emulgierten Wirkstoffe direkt nach Einsaat mittels fein verteilender Düsen aufgebracht. Die Gefäße wurden leicht beregnet, um 15 Keimung und Wachstum zu fördern, und anschließend mit durchsichtigen Plastikhauben abgedeckt, bis die Pflanzen angewachsen waren. Diese Abdeckung bewirkt ein gleichmäßiges Keimen der Testpflanzen, sofern dies nicht durch die Wirkstoffe beeinträchtigt wurde.

20 Zum Zweck der Nachauflaufbehandlung wurden die Testpflanzen je nach Wuchsform erst bis zu einer Wuchshöhe von 3 bis 15 cm angezogen und erst dann mit den in Wasser suspendierten oder emulgier-ten Wirkstoffen behandelt. Die Testpflanzen wurden dafür entweder 25 direkt gesät und in den gleichen Gefäßen aufgezogen oder sie wur- den erst als Keimpflanzen getrennt angezogen und einige Tage vor der Behandlung in die Versuchsgefäße verpflanzt. Die Aufwandmenge für die Nachauflaufbehandlung betrug 0,5 bzw. 0,25 kg/ha a.S. (aktive Substanz).

30 Die Pflanzen wurden artenspezifisch bei Temperaturen von 10 bis 25°C bzw. 20 bis 35°C gehalten. Die Versuchsperiode erstreckte sich über 2 bis 4 Wochen. Während dieser Zeit wurden die Pflanzen gepflegt, und ihre Reaktion auf die einzelnen Behandlungen wurde 35 ausgewertet.

Bewertet wurde nach einer Skala von 0 bis 100. Dabei bedeutet 100 kein Aufgang der Pflanzen bzw. völlige Zerstörung zumindest der -oberirdischen Teile und 0 keine Schädigung oder normaler 40 Wachstumsverlauf.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzten sich aus folgenden Arten zusammen:

Bayercode	Deutscher Name	Englischer Name
AMARE	Zurückgekrümpter Fuchsschwanz	redroot pigweed
5 AVEFA	Flughafner	wild oats
CHEAL	Weißen Gänsefuß	lambsquarters (goosefoot)
CAPBP	Hirtenäschelkraut	shepherd's purse
DIGSA	Blutfingerhirse	Fingergrass ,hairy
10 ECHCG	Hühnerhirse	barnyardgrass
EPHHL	Wolfsmilchart	spurge
GASPA	Knopfkraut	smallflower
15 GALAP	Klettenlabkraut	catchweed bedstraw
LAMAM	Taubnessel,stengelumfassende	henbit
MYOAR	Vergißmeinnicht	forget-me-not
PAPRH	Klatschmohn	corn poppy
20 POLPE	Flohknöterich	ladysthumb
SETIT	Borstenhirse	foxtail
STEME	Vogelsternmiere	Common chickweed
SOLNI	Schwarzer Nachtschatten	black nightshade
25 THLAR	Hellerkraut	fanweed
TRZAS	Sommer Weizen	spring wheat

Bei Aufwandmengen von 0,5 bzw. 0,25 kg/ha (a.S.) zeigte die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 1) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen die Schadpflanzen AVEFA, CHEAL, POLPE, SOLNI und GALAP.

Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,0625 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(2',4'-Dimethylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 14) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen GASPA, LAMAM, STEME, THLAR.

Bei Aufwandmengen von 0,125 bzw. 0,0625 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-benzyloxy-1-methylpyrazol (Beispiel 13) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, EPHHL, MYOAR, PAPRH, SOLNI bei Selektivität in Weizen.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(2'-Ethyl-4'-methylbenzoxazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-iso-

180

propylpyrazol (Beispiel 31) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL, LAMAM, PAPRH, POLPE, THLAR.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung  
5 4-(2',4'-Dimethylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-isopropylpyrazol (Beispiel 33) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, CHEAL, LAMAM, MYOAR, PAPRH, THLAR.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung  
10 4-(2'-Methoxymethyl-4'-methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 34) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, LAMAM, PAPRH, STEME, THLAR.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung  
15 4-(2'-Ethyl-4'-methylbenzoxazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-methylpyrazol (Beispiel 30) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, LAMAM, PAPRH, POLPE, THLAR.

Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung  
20 4-(2'-Methoxymethyl-4'-methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-isopropylpyrazol (Beispiel 36) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, EPHHL, MYOAR, PAPRH, SOLNI, STEME.

25 Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-hydroxy-1-isopropylpyrazol (Beispiel 12) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen CHEAL, LAMAM, PAPRH, STEME, THLAR.

30 Bei Aufwandmengen von 0,5 bzw. 0,25 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-(3''-fluorbenzoyl)-oxy-1-methylpyrazol (Beispiel 16) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AMARE, ECHCG, CHEAL, GALAP, POLPE.

35 Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-benzoyloxy-1-methylpyrazol (Beispiel 15) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AVEFA, AMARE, ECHCG, CHEAL, POLPE.

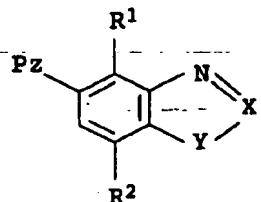
40 Bei Aufwandmengen von 0,25 bzw. 0,125 kg/ha zeigt die Verbindung 4-(4'-Methylbenzothiazol-5'-ylcarbonyl)-5-cyclopropylcarbonyloxy-1-methylpyrazol (Beispiel 18) im Nachauflauf eine sehr gute herbizide Wirkung gegen AVEFA, AMARE, ECHCG, CHEAL, POLPE.

181

**Patentansprüche**

**5 1. Pyrazolyl-Derivate benzokondensierter, ungesättigter 5-Ring-Stickstoffheterocyclen der allgemeinen Formel I,**

10



I

15

worin

X für N oder eine Gruppe C-R³ steht;

20

Y für O, S, SO, SO₂ oder NR⁴ steht

oder

25

X-Y für S=N stehen, und X Schwefel bedeutet;

30

R¹ Wasserstoff, Nitro, Halogen, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfinyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylsulfonyl,  
Aminosulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, oder  
Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)amino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl;

35

R² Wasserstoff, Halogen oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl;

40

R³ Wasserstoff, Halogen, Nitro, Cyano, Hydroxy, Amino,  
Mercapto, Rhodano, Hydrazid, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Aminoalkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkoxy,  
C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl,

## 182

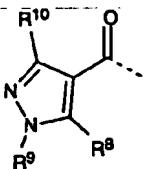
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylamino, Di-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylamino,  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkylamino, wobei die Alkyl- und  
 Cycloalkylgruppen der drei letztgenannten Reste teilweise  
 oder vollständig halogeniert und/oder ein bis drei  
 5 Substituenten, ausgewählt unter C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder Hydroxy  
 tragen können,
- C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkylthio,  
 10 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylsulfinyl,
- Phenyl, Naphthyl, Heterocyclyl, Phenylamino, Phenoxy,  
 Diphenylamino, wobei die Phenyl- und Heterocyclylgruppen  
 15 der sechs letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder  
 vollständig halogeniert und/oder einen, zwei oder drei  
 Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können,
- 20 C(O)OR<sup>5</sup>, oder C(O)N(R<sup>6</sup>)R<sup>7</sup>; und
- R<sup>4</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,
- 25 Phenyl, Naphthyl, wobei die zwei letztgenannten Reste  
 ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert und/oder  
 einen, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter  
 Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können;  
 30 bedeuten, wobei
- R<sup>5</sup> für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,
- 35 Phenyl, Naphthyl oder Heterocyclyl steht, wobei die drei  
 letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig  
 halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten,  
 ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy,  
 40 tragen können;
- R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> unabhängig voneinander für Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Hydroxyalkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,

## 183

5 Phenyl oder Naphthyl stehen, wobei die zwei letztgenannten Reste ihrerseits partiell oder vollständig halogeniert und/oder einen, zwei oder drei Substituenten, ausgewählt unter Nitro, Cyano, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können;

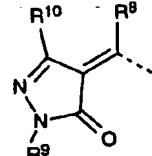
und Pz für einen Rest der Formel IIIa oder IIIb steht,

10



15

IIIa



IIIb

worin die Variablen R<sup>8</sup>, R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> folgende Bedeutung haben:

20 R<sup>8</sup> Hydroxy, Mercapto, Halogen, OR<sup>11</sup>, SR<sup>11</sup>, SOR<sup>12</sup>, SO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, P(O)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, OP(O)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, P(S)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, OP(S)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>, NR<sup>15</sup>R<sup>16</sup>, ONR<sup>15</sup>R<sup>16</sup> oder N-gebundenes Heterocyclyl, das partiell oder vollständig halogeniert sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,

25 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;

30 R<sup>9</sup> Wasserstoff, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy;

35 R<sup>10</sup> Wasserstoff, Halogen, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkyl, Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthio oder C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio; wobei

40 R<sup>11</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkinyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylcarbonyl, C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylcarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy carbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyloxycarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyloxycarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylthiocarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenylaminocarbonyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinylaminocarbonyl,

45 N,N-Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxy)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminocarbonyl,

## 184

- N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy)-aminocarbonyl,  
 N-(C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl)-N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkoxy)-aminocarbonyl,  
 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl)-aminothiocarbonyl oder  
 C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkoxyimino-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, wobei die genannten  
 5 Alkyl-, Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder  
 vollständig halogeniert sein können und/oder eine bis  
 drei der folgenden Gruppen tragen können: Cyano,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio, Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-amino,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl,  
 10 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy-C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkoxycarbonyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylaminocarbonyl,  
 Di-(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-alkyl)-aminocarbonyl, Aminocarbonyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyloxy oder C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl;
- 15 Phenyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Phenylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 Phenylcarbonyl, Phenoxy carbonyl,  
 Phenoxythiocarbonyl, Phenylaminocarbonyl,  
 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-(phenyl)-aminocarbonyl,  
 Phenyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenylcarbonyl, Heterocyclyl,  
 20 Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl,  
 Heterocyclylcarbonyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heterocyclylcarbonyl,  
 Heterocycloloxy carbonyl, Heterocycloloxythiocarbonyl,  
 Heterocyclylaminocarbonyl,  
 N-(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl)-N-(heterocyclyl)-aminocarbonyl, oder  
 25 Heterocyclyl-C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>-alkenylcarbonyl, wobei der Phenyl-  
 und der Heterocyclyl-Rest der 18 letztgenannten  
 Substituenten partiell oder vollständig halogeniert  
 sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden  
 Reste tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy oder  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy;
- 30 R<sup>12</sup> C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Alkyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkenyl, C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Alkinyl oder  
 C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>-Cycloalkyl, wobei die vier genannten Reste  
 35 partiell oder vollständig halogeniert sein können  
 und/oder eine, zwei oder drei der folgenden Gruppen  
 tragen können: Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylthio,  
 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkylcarbonyl,  
 40 C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxycarbonyl oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxycarbonyl;
- 45 Phenyl, Phenyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, Heterocyclyl oder  
 Heterocyclyl-C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-alkyl, wobei der Phenyl- und der  
 Heterocyclyl-Rest der letztgenannten Substituenten  
 partiell oder vollständig halogeniert sein kann  
 und/oder einen, zwei oder drei der folgenden Reste  
 tragen kann: Nitro, Cyano, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl,

## 185

$C_1-C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy  
oder  $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl;

- 5       $R^{13}, R^{14}$     unabhängig voneinander Wasserstoff, Hydroxy,  
        $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  $C_1-C_6$ -Alkylthio, Phenyl,  
       Phenyl- $C_1-C_4$ -alkyl oder Phenoxy, wobei die drei  
       letztgenannten Substituenten partiell oder vollständig  
       halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei  
       der folgenden Reste tragen können: Nitro, Cyano,  
 10      $C_1-C_4$ -Alkyl,  $C_1-C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxy,  
        $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy oder  $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl;
- 15      $R^{15}$     Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  $C_3-C_6$ -Alkenyl,  
        $C_3-C_6$ -Halogenalkenyl,  $C_3-C_6$ -Alkinyl,  
 20      $C_3-C_6$ -Halogenalkinyl,  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl,  
        $C_1-C_6$ -Alkylcarbonyl, Hydroxy,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  
        $C_3-C_6$ -Alkenyloxy,  $C_3-C_6$ -Alkinyloxy, Amino,  
        $C_1-C_6$ -Alkylamino, Di-( $C_1-C_6$ -alkyl)-amino oder  
        $C_1-C_6$ -Alkylcarbonylamino, wobei die genannten Alkyl-,  
 25     Cycloalkyl- und Alkoxyreste partiell oder vollständig  
       halogeniert sein können und/oder einen, zwei oder drei  
       der folgenden Reste tragen können: Cyano,  
        $C_1-C_4$ -Alkoxycarbonyl,  $C_1-C_4$ -Alkylaminocarbonyl,  
       Di-( $C_1-C_4$ -alkyl)-aminocarbonyl oder  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl;
- 30     25     Phenyl, Phenyl- $C_1-C_4$ -alkyl, Phenylcarbonyl,  
       Heterocyclyl, Heterocyclyl- $C_1-C_4$ -alkyl oder  
       Heterocyclylcarbonyl, wobei der Phenyl- oder  
       Heterocyclyl-Rest der sechs letztgenannten  
       Substituenten partiell oder vollständig halogeniert  
       sein kann und/oder einen, zwei oder drei der folgenden  
       Reste tragen kann: Nitro, Cyano,  $C_1-C_4$ -Alkyl,  
        $C_1-C_4$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_4$ -Alkoxy oder  
        $C_1-C_4$ -Halogenalkoxy; und
- 35     30      $R^{16}$     Wasserstoff,  $C_1-C_6$ -Alkyl oder  $C_3-C_6$ -Alkenyl,  
        $C_3-C_6$ -Alkinyl; bedeuten;  
       sowie deren landwirtschaftlichen brauchbaren Salze.
- 40     2.    Pyrazolderivate gemäß Anspruch 1, worin X in Formel I für  
        $C-R^3$  steht, wobei
- 45     40      $R^3$     für Wasserstoff, Halogen, Cyano, Rhodano,  $C_1-C_6$ -Alkyl,  
        $C_1-C_6$ -Halogenalkyl,  $C_1-C_6$ -Alkoxy,  $C_1-C_6$ -Alkoxy- $C_1-C_6$ -al-  
       kylyl,  $C_3-C_6$ -Cycloalkyl,  $C_1-C_6$ -Halogenalkoxy,  $C_1-C_6$ -Al-

186

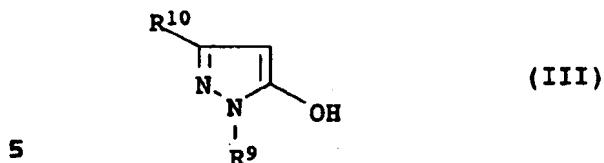
kylthio, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>-Halogenalkylthio,

5 Phenyl, Phenoxy oder Pyridyl, wobei die drei letztgenannten Reste teilweise oder vollständig halogeniert sein können und/oder einen der folgenden Reste: C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkoxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkyl, und C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Halogenalkoxy, tragen können;

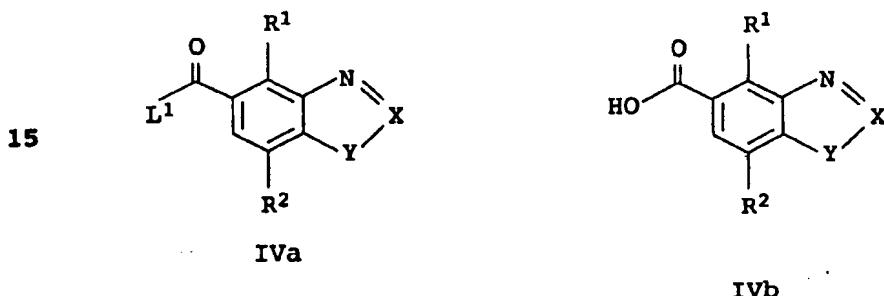
oder

10 COOR<sup>5</sup> mit den für R<sup>5</sup> in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen steht.

- 15 3. Pyrazolderivate gemäß Anspruch 1 oder 2, worin X in Formel I für C-R<sup>3</sup> steht und Y ausgewählt ist unter S, SO und SO<sub>2</sub>.
- 20 4. Pyrazolderivate gemäß einem der Ansprüche 1 oder 2, worin Y in Formel I für N-R<sup>4</sup> mit der für R<sup>4</sup> in Anspruch 1 angegebenen Bedeutung steht und X für C-R<sup>3</sup> mit den in Anspruch 1 oder 2 für R<sup>3</sup> angegebenen Bedeutungen steht.
- 25 5. Pyrazolderivate gemäß Anspruch 1, worin X für N steht und Y ausgewählt ist unter S, SO, SO<sub>2</sub> oder N-R<sup>4</sup>.
- 30 6. Pyrazolderivate gemäß einem der Ansprüche 1 bis 5, worin Pz in Formel I für einen Rest der Formel IIa steht, worin R<sup>8</sup> ausgewählt ist unter Hydroxy, OR<sup>11</sup> und OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup> mit den für R<sup>11</sup> und R<sup>12</sup> in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen, wobei R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> die in Anspruch 1 angegebenen Bedeutungen haben.
- 35 7. Pyrazolderivate gemäß Anspruch 6, wobei in Formel IIa
  - R<sup>8</sup> für Hydroxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyloxy, O-CH<sub>2</sub>-Phenyl, Phenylcarbo-nyloxy, 2-, 3- oder 4-Fluorphenylcarbonyloxy, Cyclo-propylcarbonyloxy, C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Sulfonyloxy, Phenylsulfonyloxy und 2-, 3- oder 4-Methylphenylsulfonyloxy;
  - R<sup>9</sup> für C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl oder Cyclopropyl und
  - R<sup>10</sup> für Wasserstoff oder C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>-Alkyl stehen.
- 45 8. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I mit R<sup>8</sup> = Hydroxy, gemäß Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein 5-Hydroxypyrazol der Formel III,



wobei die Variablen R<sup>9</sup> und R<sup>10</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einer aktivierten Carbonsäure IVa oder  
10 einer Carbonsäure IVb



wobei die Variablen X, Y, R<sup>1</sup> und R<sup>2</sup> die unter Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>1</sup> für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, acyliert und das Acylierungsprodukt gegebenenfalls in Gegenwart eines Katalysators zu den  
20 Verbindungen I mit R<sup>8</sup> = Hydroxy umlagert.

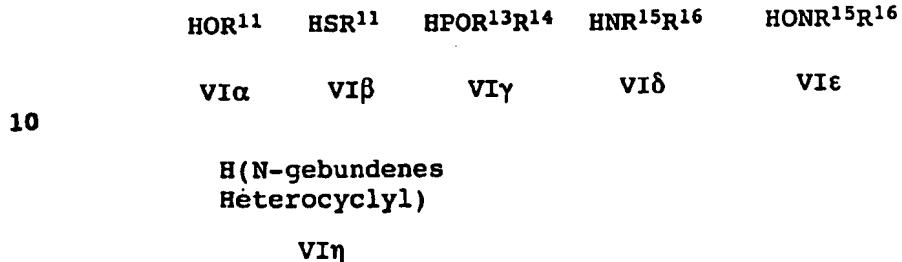
9. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit R<sup>8</sup> = Halogen, dadurch gekennzeichnet, dass man ein Pyrazol-Derivat der Formel I, mit R<sup>8</sup> = Hydroxy mit einem  
30 Halogenierungsmittel umsetzt.
10. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit R<sup>8</sup> = OR<sup>11</sup>, OSO<sub>2</sub>R<sup>12</sup>, OP(O)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup> oder OP(S)R<sup>13</sup>R<sup>14</sup>  
35 dadurch gekennzeichnet, dass man ein Pyrazol-Derivat der Formel I mit R<sup>8</sup> = Hydroxy mit einem Alkylierungsmittel Va, Sulfonylierungsmittel Vβ oder Phosphorylierungsmittel Vγ bzw. Vδ,



wobei die Variablen R<sup>11</sup> bis R<sup>14</sup> die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>2</sup> für eine nukleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umsetzt.  
45

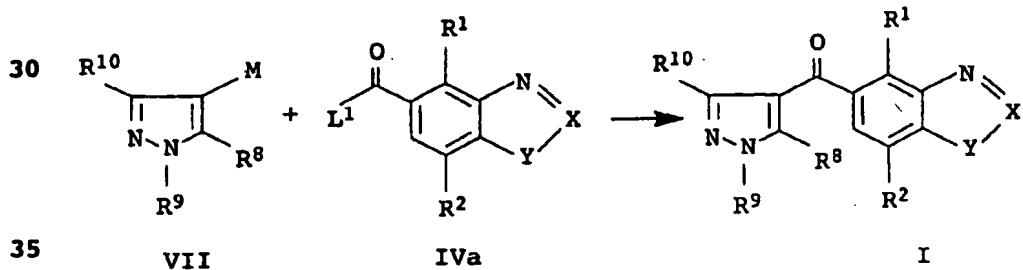
## 188

11. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I gemäß Anspruch 1 mit  $R^8 = OR^{11}$ ,  $SR^{11}$ ,  $P(O)R^{13}R^{14}$ ,  $NR^{15}R^{16}$ ,  $ONR^{15}R^{16}$  oder N-gebundenes Heterocyclyl, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Pyrazol-Derivat der Formel I mit  $R^8 =$  Halogen oder  
 5  $OSO_2R^{12}$  mit einer Verbindung der Formel VI $\alpha$ , VI $\beta$ , VI $\gamma$ , VI $\delta$ , VI $\epsilon$  oder VI $\eta$



15 wobei die Variablen  $R^8$ ,  $R^{11}$  bis  $R^{16}$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, gegebenenfalls in Gegenwart einer Base, umgesetzt.

- 20 12. Verfahren zur Herstellung von Verbindungen der Formel I, worin  $P_z = IIa$  gemäß Anspruch 1 ist, dadurch gekennzeichnet, dass man ein metalliertes Pyrazol-Derivat der Formel VII, worin M für ein Metall steht und  $R^8$  bis  $R^{10}$  die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben, mit einem Carbonsäure-Derivat der  
 25 Formel IVa, worin  $R^1$ ,  $R^2$ , X und Y die in Anspruch 1 genannte Bedeutung haben und L<sup>1</sup> für eine nucleophil verdrängbare Abgangsgruppe steht, umgesetzt.



13. Mittel, enthaltend mindestens ein Pyrazol-Derivat der Formel I oder ein landwirtschaftlich brauchbares Salz von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, und übliche Hilfsmittel.  
 40 14. Verfahren zur Bekämpfung von unerwünschtem Pflanzenwuchs, dadurch gekennzeichnet, daß man eine herbizid wirksame Menge mindestens eines Pyrazol-Derivates der Formel I oder eines landwirtschaftlich brauchbaren Salzes von I gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7, auf Pflanzen, deren Lebensraum und/oder auf Samen einwirken läßt.

**189**

- 15.** Verwendung von Pyrazol-Derivaten der Formel I oder deren landwirtschaftlich brauchbaren Salzen gemäß einem der Ansprüche 1 bis 7 als Herbizide.

**5**

**10**

**15**

**20**

**25**

**30**

**35**

**40**

**45**

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/EP 00/04040

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**

IPC 7 C07D417/06	C07D403/06	C07D413/06	A01N43/76	A01N43/78
A01N43/828	A01N43/647			

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 7 C07D A01N

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97 08164 A (DU PONT ;GEE STEPHEN KENNETH (US); HANAGAN MARY ANN (US); HONG WON) 6 March 1997 (1997-03-06) cited in the application claims 1,5 ---	1,15
A	EP 0 822 187 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 4 February 1998 (1998-02-04) cited in the application claims 1,14 ---	1,15
A	WO 96 05197 A (BASF AG ;PLATH PETER (DE); DEYN WOLFGANG VON (DE); ENGEL STEFAN (D)) 22 February 1996 (1996-02-22) cited in the application claim 1 ---	1,15

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents :

- "A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- "E" earlier document but published on or after the International filing date
- "L" document which may throw doubts on priority, claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- "O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- "P" document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

- "T" later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- "X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- "Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- "&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search Date of mailing of the international search report

9 August 2000

18/08/2000

## Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

## Authorized officer

De Jong, B

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

national Application No

PCT/EP 00/04040

## C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	WO 97 09327 A (BASF AG ; OTTEN MARTINA (DE); DEYN WOLFGANG VON (DE); ENGEL STEFAN) 13 March 1997 (1997-03-13) cited in the application abstract; claim 1 -----	1, 15

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 00/04040

Patent document cited in search report		Publication date		Patent family member(s)		Publication date
WO 9708164	A	06-03-1997		AU 6777896 A EP 0846112 A		19-03-1997 10-06-1998
EP 0822187	A	04-02-1998		AU 4632696 A US 5939559 A WO 9624589 A US 6030926 A		27-08-1996 17-08-1999 15-08-1996 29-02-2000
WO 9605197	A	22-02-1996		DE 4427997 A AU 3166695 A BR 9508553 A CA 2197118 A CN 1157616 A EP 0775136 A HU 77177 A,B JP 10506618 T US 5723415 A		15-02-1996 07-03-1996 11-11-1997 22-02-1996 20-08-1997 28-05-1997 02-03-1998 30-06-1998 03-03-1998
WO 9709327	A	13-03-1997		DE 19532312 A AU 710278 B AU 6929696 A BR 9610210 A CA 2227946 A CZ 9800602 A EP 0961774 A HU 9802345 A JP 11512105 T PL 325279 A SK 24498 A		06-03-1997 16-09-1999 27-03-1997 02-02-1999 13-03-1997 12-08-1998 08-12-1999 28-01-1999 19-10-1999 20-07-1998 04-11-1998

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

nationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/04040

A. KLASIFIZIERUNG DES ANMELDUNGSGEGENSTANDES  
 IPK 7 C07D417/06 C07D403/06 C07D413/06 A01N43/76 A01N43/78  
 A01N43/828 A01N43/647

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationsymbole)  
 IPK 7 C07D A01N

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

EPO-Internal

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 97 08164 A (DU PONT ;GEE STEPHEN KENNETH (US); HANAGAN MARY ANN (US); HONG WON) 6. März 1997 (1997-03-06) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,5	1,15
A	EP 0 822 187 A (NISSAN CHEMICAL IND LTD) 4. Februar 1998 (1998-02-04) in der Anmeldung erwähnt Ansprüche 1,14	1,15
A	WO 96 05197 A (BASF AG ;PLATH PETER (DE); DEYN WOLFGANG VON (DE); ENGEL STEFAN (D) 22. Februar 1996 (1996-02-22) in der Anmeldung erwähnt Anspruch 1	1,15
-/-		

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

\* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :

"A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist

"E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem Internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist

"L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchebericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)

"O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht

"P" Veröffentlichung, die vor dem Internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

"T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist

"X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden

"Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erfinderischer Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist

"&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der Internationalen Recherche

Abeendedatum des Internationalen Rechercheberichts

9. August 2000

18/08/2000

Name und Postanschrift der Internationalen Recherchebehörde  
 Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
 NL - 2280 HV Rijswijk  
 Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
 Fax: (+31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

De Jong, B

## INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/04040

## C.(Fortsetzung) ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
A	WO 97 09327 A (BASF AG ; OTTEN MARTINA (DE); DEYN WOLFGANG VON (DE); ENGEL STEFAN) 13. März 1997 (1997-03-13) in der Anmeldung erwähnt Zusammenfassung; Anspruch 1 -----	1,15

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen, die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 00/04040

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
WO 9708164 A	06-03-1997	AU EP	6777896 A 0846112 A	19-03-1997 10-06-1998
EP 0822187 A	04-02-1998	AU US WO US	4632696 A 5939559 A 9624589 A 6030926 A	27-08-1996 17-08-1999 15-08-1996 29-02-2000
WO 9605197 A	22-02-1996	DE AU BR CA CN EP HU JP US	4427997 A 3166695 A 9508553 A 2197118 A 1157616 A 0775136 A 77177 A,B 10506618 T 5723415 A	15-02-1996 07-03-1996 11-11-1997 22-02-1996 20-08-1997 28-05-1997 02-03-1998 30-06-1998 03-03-1998
WO 9709327 A	13-03-1997	DE AU AU BR CA CZ EP HU JP PL SK	19532312 A 710278 B 6929696 A 9610210 A 2227946 A 9800602 A 0961774 A 9802345 A 11512105 T 325279 A 24498 A	06-03-1997 16-09-1999 27-03-1997 02-02-1999 13-03-1997 12-08-1998 08-12-1999 28-01-1999 19-10-1999 20-07-1998 04-11-1998

**This Page is Inserted by IFW Indexing and Scanning  
Operations and is not part of the Official Record**

## **BEST AVAILABLE IMAGES**

Defective images within this document are accurate representations of the original documents submitted by the applicant.

Defects in the images include but are not limited to the items checked:

- BLACK BORDERS**
- IMAGE CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES**
- FADED TEXT OR DRAWING**
- BLURRED OR ILLEGIBLE TEXT OR DRAWING**
- SKEWED/SLANTED IMAGES**
- COLOR OR BLACK AND WHITE PHOTOGRAPHS**
- GRAY SCALE DOCUMENTS**
- LINES OR MARKS ON ORIGINAL DOCUMENT**
- REFERENCE(S) OR EXHIBIT(S) SUBMITTED ARE POOR QUALITY**
- OTHER:**

**IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.**

**As rescanning these documents will not correct the image problems checked, please do not report these problems to the IFW Image Problem Mailbox.**